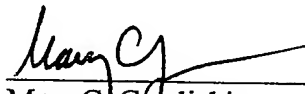




CERTIFICATION

This is to certify that Corporate Translations, Inc. has performed a true translation for *Cantor Colburn LLP* of the attached *Claims for International Patent Document No. WO2004/020416* (CTi Ref. No. LC32762). This document was prepared by a translator who is fully bilingual in both German and English.

Authorized Signature:

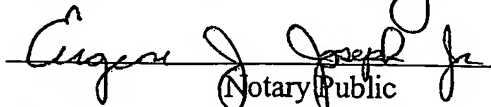


Mary C. Gawlicki
President
Corporate Translations, Inc.

May 27, 2005

"Subscribed and sworn to before me

this 27th day of May, 2005"

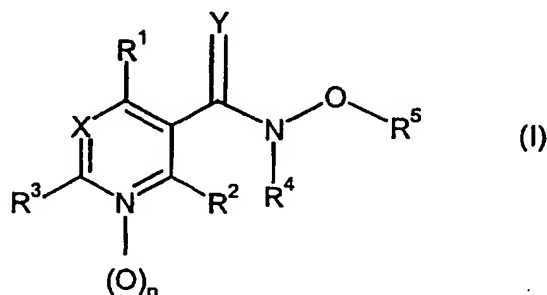


Notary Public

Date Commission Expires: 1-31-07

What is claimed is

1. The compounds of structure (I) and the salts thereof,



- 5 where the symbols and superscripts have the following meanings:

X is =CH- or =N-;

Y is =O or =S;

n is 0 or 1

- 10 R^1 is (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, -S(halogen)₅, or halogen, where one or two CH₂ groups may be substituted by -O- or -S- or -N(C₁-C₆)-alkyl, with the condition that heteroatoms must not be adjacent to each other;

R^2 , R^3 , are, independently of one another, hydrogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, or halogen, whereby one or two CH₂ groups may be substituted by -O- or -S- or -N(C₁-C₆)-alkyl, with the condition that heteroatoms must not be adjacent to each other;

- 15 R^4 is hydrogen, (C₁-C₁₀)-alkyl, (C₃-C₁₀)-alkenyl, (C₃-C₁₀)-alkinyl, (C₃-C₁₀)-cycloalkyl, (C₄-C₈)-cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-aryl, (C₃-C₁₀)-heterocyclyl or R^6 , whereby the recited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times;

- 20 R^5 is hydrogen (C₁-C₁₀)-alkyl, (C₃-C₁₀)-alkenyl, (C₃-C₁₀)-alkinyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl, C₄-C₈-cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-aryl, (C₃-C₁₀)-heterocyclyl, or R^7 , whereby the cited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times;

R^6, R^7 are, independently of one another $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8_2$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$, or $-PW(OR^8)_2$;

W is $=O$, $=S$, $=NOR^8$, or $=NNR^8_2$;

- 5 R^8 is identically or differently hydrogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -alkinyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_4-C_8) -cycloalkenyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl- (C_1-C_4) -alkyl, (C_4-C_8) -cycloalkenyl- (C_1-C_4) -alkyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl- (C_2-C_4) -alkenyl, (C_4-C_8) -cycloalkenyl- (C_2-C_4) -alkenyl, (C_1-C_6) -alkyl- (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_2-C_6) -alkenyl- (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_2-C_6) -alkinyl- (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_1-C_6) -alkyl- (C_4-C_8) -cycloalkenyl, (C_2-C_6) -alkenyl- (C_4-C_8) -cycloalkenyl, (C_6-C_{14}) -aryl, (C_3-C_{10}) -heterocyclyl, where the recited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times, and optionally two R^8 substituents together form a ring system;
- 10

with the condition that at least one of the R^4 or R^5 substituents has one of the meanings defined for R^6 or R^7 , and that, if R^5 is $-C(=O)R^a$, where R^a means (C_1-C_6) -alkyl or (C_6-C_{14}) -aryl, and where the recited substituents may be substituted one time or a multiple number of times, R^4 means hydrogen or optionally a (C_3-C_{10}) -alkenyl, (C_3-C_{10}) -alkinyl, (C_3-C_{10}) -cycloalkenyl, (C_4-C_8) -cycloalkenyl, (C_8-C_{10}) -cycloalkinyl, or R^6 .

15

2. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein X is $=CH-$.
- 20 3. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein Y is $=O$.
4. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein n is $=0$.
5. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein R^1 is CF_3 .

6. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein R^2 and R^3 are hydrogen.

7. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein R^4 means hydrogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -alkyl substituted one or more times by F and/or Cl, or it
5 means R^6 .

8. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein R^5 means (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkinyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -aryl, or (C_3-C_{10}) -heterocyclyl having a total of one to three nitrogen, oxygen, and/or sulfur ring atoms, or more preferably R^7 , where the recited substituents may optionally be substituted one time or a
10 multiple number of times.

9. Compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, wherein R^6 and R^7 independently of one another mean $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$, or $-PW(OR^8)_2$, W is =O and R^8 is identically or differently (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -alkinyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -aryl, (C_3-C_{10}) -heterocyclyl having a total
15 of one to three nitrogen, oxygen, and/or sulfur ring atoms, whereby the recited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times.

10. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, whereby the symbols and superscripts have the following meanings:

X is =CH-,

20 Y is =O;

n is =0;

R^1 is -CF₃,

R^2 and R^3 are hydrogen,

R^4 is hydrogen, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$, or $-S(O)_2R^8$;

25 R^5 is (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkinyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -aryl, (C_3-C_{10}) -heterocyclyl having a total of one to three nitrogen, oxygen, and/or sulfur ring

atoms, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$, $-S(0)R^8$, or $-S(O)_2R^8$; where the recited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times.

11. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 10, wherein the symbols and superscripts have the following meanings:

5 R^4 is $-C(W)R^8$ and is preferably hydrogen;

R^5 is $-C(W)R^8$, and

R^8 is identically or differently hydrogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_2-C_6) -alkenyl, (C_2-C_6) -alkinyl, (C_3-C_8) -cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -aryl, (C_3-C_{10}) -heterocyclyl having a total of one to three nitrogen, oxygen, and/or sulfur ring atoms, where the recited substituents may optionally be substituted one time or a multiple number of times.

12. The compounds of structure (I) and the salts thereof of Claim 1, where the substituents at the substituents R^4 , R^5 , and R^8 are R^9 groups having the following meanings:

15 R^9 is identically or differently R^{10} or two R^9 substituents form together with the atoms to which they are bonded a 3- to 8-member, saturated or unsaturated ring system, that is optionally substituted with one or more R^{10} substituents and may contain hetero atoms, preferably O, N, S, SO, and/or SO_2 ;

20 R^{10} is identically or differently R^8 , R^{11} , $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-OC(W)R^8$, $-OC(W)OR^8$, $-OC(W)SR^8$, $-OC(W)NR^8_2$, $-SC(W)R^8$, $-SC(W)OR^8$, $-SC(W)SR^8$, $-SC(W)NR^8_2$, $-NR^8C(W)R^8$, $-N[C(W)R^8]_2$, $-NR^8C(W)OR^8$, $-NR^8C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-NR^8-C(W)NR^8_2$, $-NR^8-NR^8C(W)R^8$, $-NR^8-N[C(W)R^8]_2$, $-N[(CW)R^8]-NR^8_2$, $-NR^8[(CW)NR^8_2]$, $-NR^8(C=NR^8)R^8$, $-NR^8(C=NR^8)NR^8_2$, $-O-NR^8_2$, $-O-NR^8(CW)R^8$, $-SO_2NR^8_2$, $-NR^8SO_2R^8$, $-SO_2OR^8$, $-OSO_2R^8$, $-OR^8$, $-NR^8_2$, $-SR^8$, $-SiR^8_3$, $-PR^8_2$, $-P(W)R^8_2$, $-SOR^8$, $=SO_2R^8$, $-PWR^8_2$, or $-PW(OR^8)_2$; or two R^{10} substituents are together (W), $(=N-R^8)$, $(=CR^8_2)$, $(=CHR^8)$, or $(=CH_2)$;

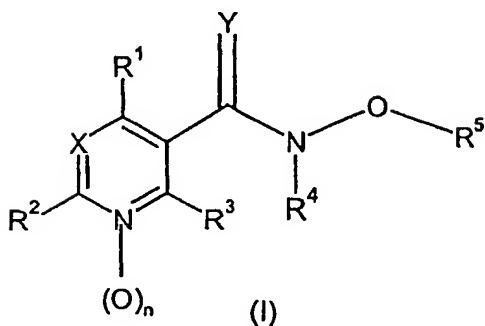
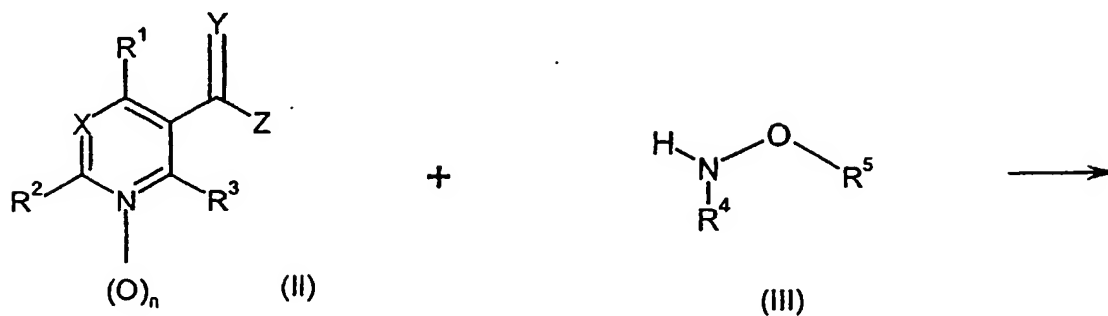
25 W and R^8 have the definitions recited in Claim 1,

R¹¹ is identically or differently halogen, cyano, nitro, hydroxy, thio, amino, formyl, (C₁-C₆)-alkanoyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₃-C₆)-alkenyloxy, (C₃-C₆)-alkinyloxy, (C₁-C₆)-haloalkyloxy, (C₃-C₆)-haloalkenyloxy, (C₃-C₆)-haloalkinyloxy, (C₃-C₈)-cycloalkoxy, (C₄-C₈)-cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-halocycloalkoxy, (C₄-C₈)-halocycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₁-C₄)-alkoxy, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₂-C₄)-alkenyloxy, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₂-C₄)-alkenyloxy, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkoxy, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₃-C₈)-cycloalkoxy, (C₂-C₆)-alkinyl-(C₃-C₈)-cycloalkoxy, (C₁-C₆)-alkyl-(C₄-C₈)-cycloalkenyloxy, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₄-C₈)-cycloalkenyloxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₄)-alkoxy-(C₃-C₆)-alkenyloxy, carbamoyl, (C₁-C₆)-mono- or dialkylcarbamoyl, (C₁-C₆)-mono or dihaloalkylcarbamoyl, (C₃-C₈)-mono- or dicycloalkylcarbamoyl, (C₁-C₆)-alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-cycloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-alkanoyloxy, (C₃-C₈)-cycloalkanoyloxy, (C₁-C₆)-haloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-haloalkanoyloxy, (C₁-C₆)-alkanamido, (C₁-C₆)-haloalkanamido, (C₂-C₆)-alkenamido, (C₃-C₈)-cycloalkanamido, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkanamido, (C₁-C₆)-alkylthio, (C₃-C₆)-alkenylthio, (C₃-C₆)-haloalkinylthio, (C₁-C₆)-haloalkylthio, (C₃-C₆)-haloalkenylthio, (C₃-C₆)-haloalkinylthio, (C₃-C₈)-cycloalkylthio, (C₄-C₈)-cycloalkenylthio, (C₃-C₈)-halocycloalkthio, (C₄-C₈)-halocycloalkenylthio, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₁-C₄)-alkylthio, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₃-C₄)-alkenylthio, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₃-C₄)-alkenylthio, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkylthio, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₃-C₈)-cycloalkylthio, (C₂-C₆)-alkinyl-(C₃-C₈)-cycloalkylthio, (C₁-C₆)-alkyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylthio, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylthio, (C₁-C₆)-alkylsulfinyl, (C₃-C₆)-alkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-alkinylsulfinyl, (C₁-C₆)-haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-haloalkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-haloalkinylsulfinyl, (C₃-C₈)-cycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-cycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-halocycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-halocycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfinyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₃-C₄)-alkenylsulfinyl, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₃-C₄)-alkenylsulfinyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-alkinyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylsulfinyl, (C₂-C₆)-alkenyl-

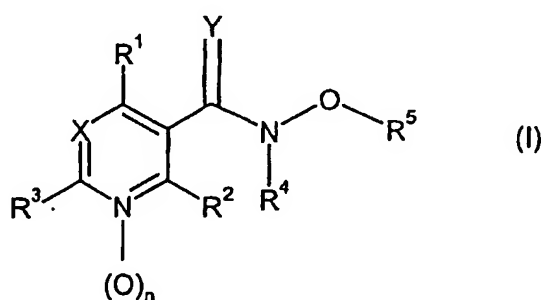
(C₄-C₈)-cycloalkenylsulfinyl, (C₁-C₆)-alkylsulfonyl, (C₃-C₆)-alkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-alkinylsulfonyl, (C₁-C₆)-haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-haloalkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-haloalkinylsulfonyl, (C₃-C₈)-cycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-cycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-halocycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-halocycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₁-C₄)-alkylsulfonyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₃-C₄)-alkenylsulfonyl, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₃-C₄)-alkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-alkinyl-(C₃-C₈)-cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-alkyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylsulfonyl, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-dialkylamino, (C₁-C₆)-alkylamino, (C₃-C₆)-alkenylamino, (C₃-C₆)-alkinylamino, (C₂-C₆)-haloalkylamino, (C₃-C₆)-haloalkenylamino, (C₃-C₆)-haloalkinylamino, (C₃-C₈)-cycloalkylamino, (C₄-C₈)-cycloalkenylamino, (C₃-C₈)-halocycloalkamino, (C₄-C₈)-halocycloalkenylamino, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkylamino, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₁-C₄)-alkylamino, (C₃-C₈)-cycloalkyl-(C₃-C₄)-alkenylamino, (C₄-C₈)-cycloalkenyl-(C₃-C₄)-alkenylamino, (C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkylamino, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₃-C₈)-cycloalkylamino, (C₂-C₆)-alkinyl-(C₃-C₈)-cycloalkylamino, (C₁-C₆)-alkyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylamino, (C₂-C₆)-alkenyl-(C₄-C₈)-cycloalkenylamino, (C₁-C₆)-trialkylsilyl, aryl, aryloxy, arylthio, arylamino, aryl-(C₁-C₄)-alkoxy, aryl-(C₃-C₄)-alkenyloxy, aryl-(C₁-C₄)-alkylthio, aryl-(C₂-C₄)-alkenylthio, aryl-(C₁-C₄)-alkylamino, aryl-(C₃-C₄)-alkenylamino, aryl-(C₁-C₆)-dialkylsilyl, diaryl-(C₁-C₆)-alkylsilyl, triarylsilyl, and 5- or 6-member heterocycl, where the cyclic part of the last 14 recited substituents is optionally substituted by one or more substituents from the group comprising halogen, cyano, nitro, amino, hydroxy, thio, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₃-C₈)-cycloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, (C₁-C₄)-haloalkoxy, (C₁-C₄)-alkylthio, (C₁-C₄)-haloalkylthio, (C₁-C₄)-alkylamino, (C₁-C₄)-haloalkylamino, formyl, and (C₁-C₄)-alkanoyl.

13. A process for preparing the compounds of structure (I) of Claim 1 comprising reacting activated carboxylic acid derivatives having the general structure (II) with hydroxylamine

derivatives of structure (III), where R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X, Y, and n have the meanings recited in Claim 1



14. A process for preparing the compounds of structure (I) of Claim 1



5

where R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X, Y, and n have the meanings recited in Claim 1 and at least one of the R^4 or R^5 substituents means $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8$, $-C(W)NR^8-NR^8$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-P(W)R^8$, or $-PW(OR^8)_2$, comprising the reaction of a compound of structure (I), where R^4 and R^5 mean hydrogen, with a compound of

10 structure (VI),



where Hal is a halogen atom and R^{12} is a substituent selected from the group comprising $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8_2$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$, and $-PW(OR^8)_2$, where W and R^8 have the meanings defined in Claim 1.

- 5 15. Agents having an insecticidal, acaricidal, ixodocidal, nematocidal, and/or molluskicidal effect, characterized by containing at least one compound of structure (I) or one of its salts as recited in Claim 1.
16. The agent of Claim 15, wherein said agent contains an additional active ingredient from the group comprising acaricides, fungicides, herbicides, insecticides, nematocides, or
10 growth-regulating substances.
17. A process for combating, defending against, or driving off pests and/or undesirable organisms from plants, wherein the plants and/or pests and/or undesirable organisms are treated with an effective quantity of a compound of structure (I) or of one of its salts of Claim 1.
- 15 18. The process of Claim 17, wherein the plant is a transgenic cultivated plant.
19. The use of compounds of structure (I) or the salts thereof of Claim 1 for combating, defending from or driving off pests and/or undesirable organisms from plants.
20. The use of the compounds of structure (I) or the salts thereof in accordance with Claim 1 for preparing a medicinal product for combating endo-, and ectoparasites.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. März 2004 (11.03.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/020416 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/00

Homburg v. d. H. (DE). HEMPEL, Waltraud [DE/DE];
Zum Morgengraben 18, 65835 Liederbach (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/009028

(22) Internationales Anmeldedatum:
14. August 2003 (14.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 39 905.0 30. August 2002 (30.08.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): BAYER CROPSCIENCE GMBH [DE/DE]; Brün-
ingstrasse 50, 65926 Frankfurt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AU,
AZ, BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ,
EC, GD, GE, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NI, NO,
NZ, OM, PG, PH, PL, RU, SC, SG, SY, TJ, TM, TN, TT,
UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BECKMANN, Marion
[DE/DE]; Dreiweidenstrasse 8, 65195 Wiesbaden (DE).
DÖLLER, Uwe [DE/DE]; Rembrandtring 24a, 63110
Rodgau (DE). KRAUTSTRUNK, Gerhard [DE/DE];
Franz-Lehar-Weg 48, 61118 Bad Vilbel (DE). SCHAPER,
Wolfgang [DE/DE]; Kapellenweg 5c, 86420 Diedorf (DE).
JANS, Daniela [DE/DE]; Schöne Aussicht 11, 61348 Bad

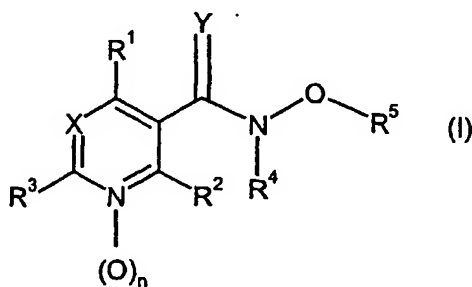
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu ver-
öffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED PYRIDINES OR PYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION, AGENTS CONTAINING
SAID SUBSTANCES AND THE USE THEREOF AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PYRIDINE ODER PYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE ENT-
HALTENDE MITTEL UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL



(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I),
whereby the symbols and indices are defined as cited in the description.
Said compounds are suitable for controlling pests.

(57) Zusammenfassung: Beschrieben werden Verbindungen der For-
mel (I) wobei die Symbole und Indizes die in der Beschreibung angege-
ben Bedeutungen haben. Diese eignen sich zur Bekämpfung von Schäd-
lingen.

WO 2004/020416 A2

Beschreibung

Substituierte Pyridine oder Pyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel

5

Die Erfindung betrifft heterocyclische Hydroxamsäurederivate, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Arthropoden, wie Insekten und Spinnentiere, und Helminthen, beispielsweise Nematoden.

10

Wegen des enormen Schadens, den Insekten beispielsweise durch Fraß an Nutzpflanzen, Lebensmittelvorräten, Holz und Textilien oder auch durch Krankheitsübertragung auf Mensch, Haustiere und Nutzpflanzen verursachen, ist die Verwendung von Insektiziden oder Repellentien nach wie vor unverzichtbar. Insektizide sind ein wichtiger Bestandteil der integrierten Schädlingskontrolle und tragen entscheidend zu Ernteertrag und Kontinuität der Ernten in aller Welt bei.

15

Aus der WO-A-01/09104 sind Trifluormethylpyri(mi)din-Hydroxamsäurederivate als Schädlingsbekämpfungsmittel bekannt. Die allgemeine Formel der beschriebenen Verbindungen umfaßt auch Pyri(mi)din-N-acyl-hydroxamsäurederivate. Konkret offenbart werden Pyri(mi)din-N-Aryl-acylhydroxamsäurederivate und Pyri(mi)din-N-(methyl)benzoyl-hydroxamsäurederivate.

20

Da sich die ökologischen und ökonomischen Anforderungen an moderne Insektizide laufend erhöhen, beispielsweise was Toxizität, Selektivität, Aufwandmenge, Rückstandsbildung und günstige Herstellbarkeit angeht, und außerdem z.B. Probleme mit Resistenzen auftreten können, besteht die ständige Aufgabe, neue Insektizide zu entwickeln, die zumindest in Teilbereichen Vorteile gegenüber den bekannten aufweisen.

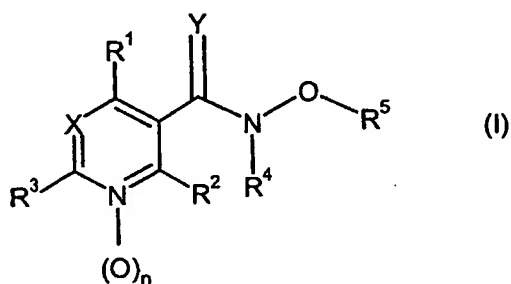
25

30

Es wurde gefunden, daß Verbindungen der allgemeinen Formel (I), gegebenenfalls auch als Salze, ein gutes Wirkungsspektrum gegenüber tierischen Schädlingen bei gleichzeitig guter Pflanzenverträglichkeit und günstigen toxikologischen Eigenschaften gegenüber Säugetieren und aquatischen Lebewesen aufweisen.

5

Gegenstand der Erfindung sind daher Verbindungen der Formel (I) und deren Salze,



10 wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

X ist =CH- oder =N-;

Y ist =O oder =S;

n ist 0 oder 1;

15 R^1 ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, -S(Halogen)₅ oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

20 R^2, R^3 sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

25 R^4 ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl oder R⁶, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;

R^5 ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl,

- (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl oder R⁷, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;
- R⁶ und R⁷ sind unabhängig voneinander -C(W)R⁸, -C(W)OR⁸, -C(W)SR⁸, -C(W)NR⁸₂, -C(W)NR⁸-NR⁸₂, -C(W)NR⁸-NR⁸[C(W)R⁸], -SO₂NR⁸₂, -SO₂OR⁸, -S(O)R⁸, -S(O)₂R⁸, -PWR⁸₂ oder -PW(OR⁸)₂;
- W ist =O, =S, =NOR⁸ oder =NNR⁸₂;
- R⁸ ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl, (C₂-C₆)-Alkynyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können und gegebenenfalls zwei Reste R⁸ zusammen ein Ringsystem bilden;
- mit der Maßgabe, daß mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ eine der für R⁶ oder R⁷ definierten Bedeutungen besitzt, und daß, falls R⁵ -C(=O)R^a ist, wobei R^a (C₁-C₆)-Alkyl oder (C₆-C₁₄)-Aryl bedeutet und wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können, R⁴ Wasserstoff oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiertes (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkynyl oder R⁶ bedeutet.
- Bevorzugt haben die Symbole und Indizes in Formel (I) folgende Bedeutungen:
- X ist vorzugsweise =CH-;
- Y ist vorzugsweise =O;
- n ist vorzugsweise 0;
- R¹ ist vorzugsweise (C₁-C₆)-Haloalkyl oder -SF₅, insbesondere ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C₁-C₆)-Alkyl, besonders bevorzugt CF₃, CHF₂ oder CF₂Cl, ganz besonders bevorzugt CF₃;

- R^2, R^3 sind vorzugsweise Wasserstoff, Halogen, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_1-C_6) -Alkoxy, $NH(C_1-C_6)$ -Alkyl, $N(C_1-C_6)_2$ -Alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff;
- R^4 ist vorzugsweise Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C_1-C_6) -Alkyl, besonders bevorzugt Wasserstoff oder CH_3 , oder R^6 ;
- R^5 ist vorzugsweise (C_1-C_6) -Alkyl, (C_3-C_6) -Alkenyl, (C_3-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl oder (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen oder ganz besonders bevorzugt R^7 , wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;
- R^6 und R^7 sind vorzugsweise unabhängig voneinander $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$;
- W ist vorzugsweise $=O$;
- R^8 ist gleich oder verschieden vorzugsweise Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
- Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), für die die Symbole und Indizes folgende Bedeutung haben:
- X ist $=CH-$,
- Y ist $=O$;
- n ist 0,
- R^1 ist $-CF_3$,
- R^2 und R^3 sind Wasserstoff,
- R^4 ist Wasserstoff, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$ oder $-S(O)_2R^8$;
- R^5 ist (C_1-C_6) -Alkyl, (C_3-C_6) -Alkenyl, (C_3-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$ oder $-S(O)_2R^8$;

R^8 ist gleich oder verschieden vorzugsweise Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste
5 gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können; wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.

Ganz besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), für die die
10 Symbole und Indizes folgende Bedeutung haben:

X ist =CH-,
Y ist =O;
n ist 0,
15 R^1 ist $-CF_3$,
 R^2 und R^3 sind Wasserstoff,
 R^4 ist $-C(W)R^8$ und insbesondere Wasserstoff;
 R^5 ist $-C(W)R^8$, und
 R^8 ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl,
20 (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl
mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder
Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein-
oder mehrfach substituiert sein können.

25 Als Substituenten an den Resten R^4 , R^5 und R^8 sind bevorzugt Gruppen R^9 , mit der folgenden Bedeutung:

R^9 ist gleich oder verschieden R^{10} oder zwei Reste R^9 bilden zusammen
30 mit den Atomen, an die sie gebunden sind, ein drei- bis achtegliedriges,
gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls mit einem oder
mehreren Resten R^{10} substituiertes Ringsystem, das gegebenenfalls
Heteroatome, vorzugsweise O, N, S, SO und/oder SO_2 , enthält;

6

- R^{10} ist gleich oder verschieden R^8 , R^{11} , $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-OC(W)R^8$, $-OC(W)OR^8$, $-OC(W)SR^8$, $-OC(W)NR^8_2$, $-SC(W)R^8$, $-SC(W)OR^8$, $-SC(W)SR^8$, $-SC(W)NR^8_2$, $-NR^8C(W)R^8$, $-N[C(W)R^8]_2$, $-NR^8C(W)OR^8$, $-NR^8C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-NR^8-C(W)NR^8_2$, $-NR^8-NR^8C(W)R^8$, $-NR^8-N[C(W)R^8]_2$, $-N[(CW)R^8]-NR^8_2$, $-NR^8[(CW)NR^8_2]$, $-NR^8(C=NR^8)R^8$, $-NR^8(C=NR^8)NR^8_2$, $-O-NR^8_2$, $-O-NR^8(CW)R^8$, $-SO_2NR^8_2$, $-NR^8SO_2R^8$, $-SO_2OR^8$, $-OSO_2R^8$, $-OR^8$, $-NR^8_2$, $-SR^8$, $-SiR^8_3$, $-PR^8_2$, $-P(W)R^8_2$, $-SOR^8$, $-SO_2R^8$, $-PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$;
- oder zwei Reste R^{10} sind zusammen (W), $(=N-R^8)$, $(=CR^8_2)$, $(=CHR^8)$, oder $(=CH_2)$;
- W und R^8 die oben definierte Bedeutung besitzen;
- R^{11} ist gleich oder verschieden Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Thio, Amino, Formyl, (C_1-C_6) -Alkanoyl, (C_1-C_6) -Alkoxy, (C_3-C_6) -Alkenyloxy, (C_3-C_6) -Alkinyloxy, (C_1-C_6) -Haloalkyloxy, (C_3-C_6) -Haloalkenyloxy, (C_3-C_6) -Haloalkinyloxy, (C_3-C_8) -Cycloalkoxy, (C_4-C_8) -Cycloalkenyloxy, (C_3-C_8) -Haloalkoxy, (C_4-C_8) -Haloalkenyloxy, (C_3-C_8) -Cycloalkyl- (C_1-C_4) -Alkoxy, (C_4-C_8) -Cycloalkenyl- (C_1-C_4) -Alkoxy, (C_3-C_8) -Cycloalkyl- (C_2-C_4) -Alkenyloxy, (C_4-C_8) -Cycloalkenyl- (C_2-C_4) -Alkenyloxy, (C_1-C_6) -Alkyl- (C_3-C_8) -Cycloalkoxy, (C_2-C_6) -Alkenyl- (C_3-C_8) -Cycloalkoxy, (C_2-C_6) -Alkinyl- (C_3-C_8) -Cycloalkoxy, (C_1-C_6) -Alkyl- (C_4-C_8) -Cycloalkenyloxy, (C_2-C_6) -Alkenyl- (C_4-C_8) -Cycloalkenyloxy, (C_1-C_4) -Alkoxy- (C_1-C_6) -Alkoxy, (C_1-C_4) -Alkoxy- (C_3-C_6) -Alkenyloxy, Carbamoyl, (C_1-C_6) -Mono- oder Dialkylcarbamoyl, (C_1-C_6) -Mono- oder Dihaloalkylcarbamoyl, (C_3-C_8) -Mono- oder Dicycloalkylcarbamoyl, (C_1-C_6) -Alkoxycarbonyl, (C_3-C_8) -Cycloalkoxycarbonyl, (C_1-C_6) -Alkanoyloxy, (C_3-C_8) -Cycloalkanoyloxy, (C_1-C_6) -Haloalkoxycarbonyl, (C_1-C_6) -Haloalkanoyloxy, (C_1-C_6) -Alkanamido, (C_1-C_6) -Haloalkanamido, (C_2-C_6) -Alkenamido, (C_3-C_8) -Cycloalkanamido, (C_3-C_8) -Cycloalkyl- (C_1-C_4) -Alkanamido, (C_1-C_6) -Alkylthio, (C_3-C_6) -Alkenylthio, (C_3-C_6) -Alkinylthio, (C_1-C_6) -Haloalkylthio, (C_3-C_6) -Haloalkenylthio, (C_3-C_6) -Haloalkinylthio, (C_3-C_8) -Cycloalkylthio, (C_4-C_8) -Cycloalkenylthio, (C_3-C_8) -

Halocycloalkthio, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylthio, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylthio, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylthio, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylthio, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylthio, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Alkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-Alkynylsulfinyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Haloalkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-Haloalkynylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-Halocycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Alkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-Alkynylsulfonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Haloalkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-Haloalkynylsulfonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-Halocycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkynyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-Dialkylamino, (C₁-C₆)-Alkylamino, (C₃-C₆)-Alkenylamino, (C₃-C₆)-Alkynylamino, (C₂-C₆)-Haloalkylamino, (C₃-C₆)-Haloalkenylamino, (C₃-C₆)-Haloalkynylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₃-C₈)-Halocycloalkamino, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylamino, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-

- Alkenylamino, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylamino, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₂-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₁-C₆)-Trialkylsilyl, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl-(C₁-C₄)-Alkoxy, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenyloxy, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylthio, Aryl-(C₂-C₄)-Alkenylthio, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylamino, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenylamino, Aryl-(C₁-C₆)-Dialkylsilyl, Diaryl-(C₁-C₆)-Alkylsilyl, Triarylsilyl und 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, wobei der cyclische Teil der vierzehn
- 10 letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylamino, Formyl und (C₁-C₄)-Alkanoyl substituiert ist.
- 15 R¹¹ ist bevorzugt gleich oder verschieden Halogen, Cyano, Nitro, (C₁-C₆)-Alkanoyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Haloalkyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₆)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl,
- 20 (C₁-C₆)-Alkylthio, (C₁-C₆)-Haloalkylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-Dialkylamino, (C₁-C₆)-Alkylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₁-C₆)-Trialkylsilyl, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-(C₁-C₄)-alkyl, Arylamino,
- 25 Aryl-(C₁-C₄)-Alkoxy, wobei der cyclische Teil der sechs letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy und (C₁-C₄)-Haloalkoxy substituiert ist.
- 30 Die Bezeichnung "Halogen" umfaßt Fluor, Chlor, Brom und Iod. Vorzugsweise handelt es sich um Chlor oder um Fluor.

Die Bezeichnung „S(Halogen)₅“ umfasst die Gruppen -SI₅, -SBr₅, -SCI₅ und insbesondere -SF₅.

Unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl" ist ein unverzweigter oder verzweigter Kohlenwasserstoffrest mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen, wie z.B. der Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, 1-Butyl-, 2-Butyl-, 2-Methylpropyl-, tert.-Butyl-, 1-Pentyl-, 2-Methylbutyl-, 1,1-Dimethylpropyl- oder 1-Hexylrest zu verstehen. Entsprechend ist unter Alkylresten mit einem größeren Bereich an Kohlenstoffatomen ein unverzweigter oder verzweigter gesättigter Kohlenwasserstoffrest zu verstehen, der eine Anzahl an Kohlenstoffatomen enthält, die dieser Bereichsangabe entspricht.

Unter "(C₁-C₆)-Haloalkyl" ist eine unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl" genannte Alkylgruppe zu verstehen, in der ein oder mehrere Wasserstoffatome durch die gleiche Anzahl gleicher oder verschiedener Halogenatome, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sind, wie die Trifluormethyl-, die 1-Fluorethyl-, die 2,2,2-Trifluorethyl-, die Chlormethyl-, Fluormethyl-, die Difluormethyl- und die 1,1,2,2-Tetrafluorethylgruppe.

Unter "(C₁-C₆)-Alkoxy" ist eine Alkoxygruppe zu verstehen, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat. Sinngemäß sind Alkoxygruppen zu verstehen, die einen größeren Bereich an Kohlenstoffatomen umfassen.

Die Bezeichnungen "Alkenyl" und "Alkinyl" mit einer vorangestellten Bereichsangabe von Kohlenstoffatomen bedeuten einen geradkettigen oder verzweigten Kohlenwasserstoffrest mit einer dieser Bereichsangabe entsprechenden Kohlenstoffatomzahl, der mindestens eine Mehrfachbindung beinhaltet, wobei sich diese an beliebiger Position des betreffenden ungesättigten Restes befinden kann. "(C₂-C₄)-Alkenyl" steht demnach z.B. für die Vinyl-, Allyl-, 2-Methyl-2-propen- oder 2-Butenyl-Gruppe; "(C₂-C₆)-Alkenyl" steht für die vorstehend genannten Reste sowie z.B. für die Pentenyl-, 2-Methylpentenyl- oder die Hexenyl-Gruppe. "(C₂-C₄)-Alkinyl" steht z.B. für die Ethinyl-, Propargyl-, 2-Methyl-2-propin- oder 2-Butinyl-Gruppe.

Unter "(C₂-C₆)-Alkynyl" sind die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Pentynyl- oder die 2-Hexynyl-Gruppe und unter "(C₂-C₁₀)-Alkynyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Octynyl- oder die 2-Decynyl-Gruppe zu verstehen.

- 5 "(C₃-C₈)-Cycloalkyl" steht für monocyclische Alkylreste, wie den Cyclopropyl-, Cyclobutyl-, Cyclopentyl-, Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctylrest und für bicyclische Alkylreste, wie den Norbornylrest.

- Unter dem Ausdruck "(C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-alkyl" ist beispielsweise der
10 Cyclopropylmethyl-, Cyclopentylmethyl-, Cyclohexylmethyl-, Cyclohexylethyl- und Cyclohexylbutyl-Rest und unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkyl" beispielsweise der 1-Methyl-cyclopropyl-, 1-Methyl-cyclopentyl-, 1-Methyl-cyclohexyl-, 3-Hexyl-cyclobutyl- und 4-tert.-Butyl-cyclohexyl-Rest zu verstehen.

- 15 "(C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₆)-alkyloxy" bedeutet eine wie vorstehend definierte Alkoxy-Gruppe, die durch eine weitere Alkoxy-Gruppe substituiert ist, wie z.B. 1-Ethoxyethoxy.

- Unter "(C₃-C₈)-Cycloalkoxy" oder "(C₃-C₈)-Cycloalkylthio" ist einer der oben
20 angeführten (C₃-C₈)-Cycloalkyl-Reste, der über ein Sauerstoff- oder Schwefelatom verknüpft ist, zu verstehen.

- "(C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₆)-alkoxy" bedeutet z.B. die Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy-, Cyclopentylmethoxy-, Cyclohexylmethoxy-, Cyclohexylethoxy-
25 oder die Cyclohexylbutoxy-Gruppe;

Der Ausdruck "(C₁-C₄)-Alkyl-(C₃-C₈)-cycloalkoxy" steht z.B. für die Methylcyclopropyloxy-, Methylcyclobutyloxy- oder die Butylcyclohexyloxy-Gruppe.

- 30 "(C₁-C₆)-Alkylthio" steht für eine Alkylthiogruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck "(C₁-C₆)-Alkyl" angegebene Bedeutung hat.

Analog bedeuten "(C₁-C₆)-Alkylsulfinyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfinyl-Gruppe und "(C₁-C₆)-Alkylsulfonyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfonyl-Gruppe.

5

"(C₁-C₆)-Alkylamino" steht für ein Stickstoffatom, das durch ein oder zwei, gleiche oder verschiedene Alkylreste der obigen Definition substituiert ist.

Der Ausdruck "(C₁-C₆)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl" bedeutet eine

Carbamoylgruppe mit einem oder zwei Kohlenwasserstoffresten, die die unter dem

- 10 Ausdruck "(C₁-C₆-Alkyl)" angegebene Bedeutung haben und die im Fall von zwei Kohlenwasserstoffresten gleich oder verschieden sein können.

Analog bedeutet "(C₁-C₆)-Dihaloalkylcarbamoyl" eine Carbamoylgruppe, die zwei (C₁-C₆)-Haloalkylreste gemäß der obigen Definition oder einen (C₁-C₆)-Haloalkylrest

- 15 und einen (C₁-C₆)-Alkylrest gemäß der obigen Definition trägt.

"(C₁-C₆)-Alkanoyl" steht z.B. für die Formyl-, Acetyl-, Propionyl-, Butyryl- oder 2-Methylbutyryl-Gruppe;

- 20 Unter dem Ausdruck "(C₆-C₁₄)-Aryl" ist ein carbocyclischer, d.h. aus Kohlenstoffatomen aufgebauter, aromatischer Rest mit 6 bis 14, insbesondere 6 bis 12 C-Atomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl oder Biphenyl, vorzugsweise Phenyl, zu verstehen.

- 25 "Aroyl" bedeutet demnach einen wie vorstehend definierten Arylrest, der über eine Carbonyl-Gruppe gebunden ist, wie z.B. die Benzoyl-Gruppe.

- Der Ausdruck "(C₃-C₁₀)-Heterocyclyl" steht für einen cyclischen Rest, der drei bis zehn C-Atome aufweist, der vollständig gesättigt, teilweise ungesättigt oder
- 30 vollständig ungesättigt bzw. aromatisch sein kann und der durch ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Atome aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel oder Sauerstoff unterbrochen ist, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome direkt

benachbart sein dürfen und noch mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß, wie z.B. ein Rest von Thiophen, Furan, Pyrrol, Thiazol, Oxazol, Imidazol, Isothiazol, Isoxazol, Pyrazol, 1,3,4-Oxadiazol, 1,3,4-Thiadiazol, 1,3,4-Triazol, 1,2,4-Oxadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, 1,2,3-Triazol, 5 1,2,3,4-Tetrazol, Benzo[b]thiophen, Benzo[b]furan, Indol, Benzo[c]thiophen, Benzo[c]furan, Isoindol, Benzoxazol, Benzothiazol, Benzimidazol, Benzisoxazol, Benzisothiazol, Benzopyrazol, Benzothiadiazol, Benzotriazol, Dibenzofuran, Dibenzothiophen, Carbazol, Pyridin, Pyrazin, Pyrimidin, Pyridazin, 1,3,5-Triazin, 1,2,4-Triazin, 1,2,4,5-Tetrazin, Chinolin, Isochinolin, Chinoxalin, Chinazolin, Cinnolin, 10 1,8-Naphthyridin, 1,5-Naphthyridin, 1,6-Naphthyridin, 1,7-Naphthyridin, Phthalazin, Pyridopyrimidin, Purin, Pteridin, 4H-Chinolizin, Piperidin, Pyrrolidin, Oxazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Isoxazolidin, Isoxazolin, Thiazolin, Morpholin, Piperazin, Oxiran, Oxetan oder Thiazolidin. Der Ausdruck "Heteroaromat" umfaßt demnach von den vorstehend unter "Heterocyclyl" genannten Bedeutungen jeweils 15 die vollständig ungesättigten aromatischen heterocyclischen Verbindungen.

Heterocyclyl bedeutet bevorzugt ein gesättigtes, teilgesättigtes oder aromatisches Ringsystem mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 4 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, wobei mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß.

20

Ganz besonders bevorzugt bedeutet Heterocyclyl ein Radikal des Pyridin, Pyrimidin, (1,2,4)-Oxadiazol, (1,3,4)-Oxadiazol, Pyrrol, Furan, Thiophen, Oxazol, Thiazol, Imidazol, Pyrazol, Isoxazol, 1,2,4-Triazol, Tetrazol, Pyrazin, Pyridazin, Oxazolin, Thiazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Morpholin, Piperidin, Piperazin, 25 Pyrrolin, Pyrrolidin, Oxazolidin, Thiazolidin, Oxiran und Oxetan.

"Aryl-(C₁-C₄)-alkoxy" steht für einen über eine (C₁-C₄)-Alkoxygruppe verknüpften Arylrest, z.B. den Benzyloxy-, Phenylethoxy-, Phenylbutoxy- oder Naphthylmethoxy-Rest.

30

"Arylthio" bedeutet einen über ein Schwefelatom verknüpften Arylrest, z.B. den Phenylthio- oder den 1- oder 2-Naphthylthio-Rest. Analog bedeutet "Aryloxy" z.B. den Phenoxy- oder 1- oder 2-Naphthylloxy-Rest.

- 5 "Aryl-(C₁-C₄)-alkylthio" steht für einen Arylrest, der über einen Alkylthiorest verknüpft ist, z.B. der Benzylthio-, Naphthylmethylthio- oder die Phenylethylthio-Rest.

- Der Ausdruck "(C₁-C₆)-Trialkylsilyl" bedeutet ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Alkylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen
- 10 Definition trägt. Analog stehen "Aryl-(C₁-C₆)-Dialkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Arylrest und zwei gleiche oder verschiedene Alkylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen Definition trägt, "Diaryl-(C₁-C₆)-Alkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Alkylrest mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen und zwei gleiche oder verschiedene Arylreste gemäß der obigen Definition trägt, und
- 15 "Triarylsilyl" für ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Arylreste mit ein bis sechs Kohlenstoffatomen gemäß der obigen Definition trägt.

Zu den Substituenten, mit denen die verschiedenen aliphatischen, aromatischen und heterocyclischen Ringsysteme versehen sein können, zählen bevorzugt

- 20 Halogen, Nitro, Cyano, Di-(C₁-C₄)-alkylamino, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Trialkylsilyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₂)-Alkoxy-[CH₂CH₂]_{1,2}-ethoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Halogenphenoxy, (C₁-C₄)-Alkylthiophenoxy, (C₁-C₄)-Alkoxyphenoxy, (C₁-C₄)-Alkylthiophenoxy, Phenylthio, Heterocyclyl, Heterocyclylthio, Heterocycliloxy,
- 25 Halogenheterocycliloxy, Alkylheterocycliloxy oder Alkoxyheterocycliloxy, wobei in den Alkylresten und den davon abgeleiteten Resten eines oder mehrere Wasserstoffatome, im Falle von Fluor auch bis zur Maximalanzahl durch Halogen, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sein können.
- 30 Besonders bevorzugte Substituenten sind, insbesondere bei cyclischen Systemen, Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio, (C₁-C₄)-

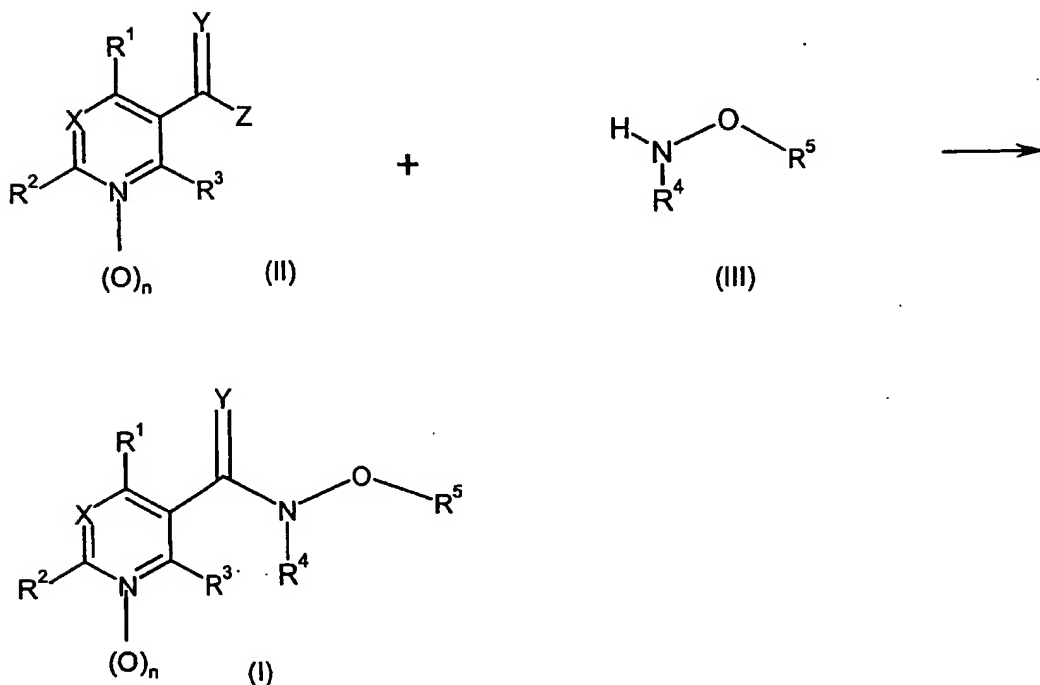
Haloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylamino, Formyl und (C₁-C₄)-Alkanoyl.

- Je nach Art der oben definierten Substituenten weisen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) saure oder basische Eigenschaften auf und können Salze bilden. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Hydroxy, Carboxy oder andere, saure Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Basen zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Basen sind beispielsweise Hydroxide, Carbonate, Hydrogencarbonate der Alkali- und Erdalkalimetalle, insbesondere die von Natrium, Kalium, Magnesium und Calcium, weiterhin Ammoniak, primäre, sekundäre und tertiäre Amine mit (C₁-C₄)-Alkylresten sowie Mono-, Di- und Trialkanolamine von (C₁-C₄)-Alkanolen. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Amino, Alkylamino oder andere, basische Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Säuren zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Säuren sind beispielsweise Mineralsäuren, wie Salz-, Schwefel- und Phosphorsäure, organische Säuren, wie Essigsäure oder Oxalsäure, und saure Salze, wie NaHSO₄ und KHSO₄. Die so erhältlichen Salze weisen ebenfalls insektizide, akarizide und mitizide Eigenschaften auf.
- Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können ein asymmetrisches Schwefelatom und/oder eines oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome oder Stereoisomere an Doppelbindungen aufweisen. Es können daher Enantiomere oder Diastereomere auftreten. Die Erfindung umfaßt sowohl die reinen Isomeren als auch deren Gemische. Die Gemische von Diastereomeren können nach gebräuchlichen Methoden, z.B. durch selektive Kristallisation aus geeigneten Lösungsmitteln oder durch Chromatographie in die Isomeren aufgetrennt werden. Racemate können nach üblichen Methoden in die Enantiomeren aufgetrennt werden.
- Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen kann unter Reaktionsbedingungen erfolgen, die für die genannten Umsetzungen bekannt und geeignet sind. Dabei kann man auch von an sich bekannten, hier nicht näher erwähnten Varianten

Gebrauch machen. Die Ausgangsstoffe können gewünschtenfalls auch in situ gebildet werden, und zwar derart, daß man sie aus dem Reaktionsgemisch nicht isoliert, sondern sofort weiter zu den Verbindungen der Formel (I) umsetzt.

- 5 Hydroxamsäurederivate der allgemeinen Formel (I), worin R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X, Y und n die oben angegebenen Bedeutungen haben, lassen sich aus der Reaktion von aktivierten Säurederivaten der Formel (II) mit Hydroxylaminderivaten der Formel (III) gemäß dem nachfolgenden Schema erhalten. Z in Formel (II) kann ein Halogen, wie Chlor oder Brom, sein.

10



- 15 Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auch durch Derivatisierung der unsubstituierten Hydroxamsäure (I); R^4 und R^5 ist Wasserstoff) oder durch Substitution, wenn R^4 oder R^5 Wasserstoff ist, erhalten werden.

Allgemeine Vorschriften zur Darstellung von substituierten Hydroxamsäuren findet man bei D. Döpp und H. Döpp in Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Auflage, Band E5 II, S.1141, Thieme Verlag, Stuttgart, 1984.

- 5 Für die Aktivierung der Säure ((II); Z = Hydroxyl) kann die Umsetzung zum Säurehalogenid ((II), Z = Halogenid) benutzt werden. Mögliche Halogenierungsreagenzien sind beispielsweise Oxalylchlorid, POCl_3 , PCl_3 , PCl_5 , SOCl_2 oder SO_2Cl_2 .

- Die so erhaltenen Säurehalogenide können dann weiter mit Hydroxylamin ((III), R^4 , R^5 = Wasserstoff) oder auch mit Hydroxylaminderivaten (III) umgesetzt werden (Literatur: Jenks, J. Amer. Chem. Soc. (1958), 80, 4585; Beckmann, Chem. Ber. (1993), 26, 2625). Als typische Methode wird das Säurehalogenid ((II); Z = Halogenid) mit Hydroxylaminderivaten (III) in Gegenwart einer Base umgesetzt. Geeignete Basen sind z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate oder organische Basen, wie z.B. Trialkylamine oder Pyridine. Eingesetzt werden können auch Festphasen-gebundene Basen, wie z.B. S-Trisamine von Agilent oder Polystyrene AM NH_2 von Rapp. Die Reaktion wird vorteilhaft in einem inerten Lösemittel, wie z.B. Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Benzol, Toluol, Diethylether oder Tetrahydrofuran, oder auch in Gemischen dieser Lösemittel in einem Temperaturbereich zwischen 0°C und 100°C , vorzugsweise 20°C bis 50°C durchgeführt.
- 10
15
20

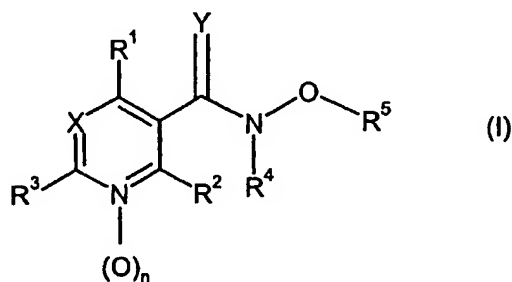
- Alternativ kann die Säure auch direkt unter Zuhilfenahme von Kupplungsreagenzien, wie Carbonyldiimidazol (CDI), Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder N-Ethyl-N'-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimide hydrochloride (EDAC) mit Hydroxylaminderivaten umgesetzt werden (Literatur: D. Geffken, G. Zimmer, Chem. Ber. (1973) 106, 2246; M. Miller et al., J. Amer. Chem. Soc. (1980), 120, 7026). Möglich ist auch eine direkte Umsetzung der Ester ((II), $\text{X} = \text{OR}$) mit den Hydroxylaminderivaten (III).
- 25

- 30 Substituierte Hydroxamsäuren, in denen R^5 gleich Wasserstoff ist, können z.B. auch durch Hydrierung mit z.B. Wasserstoff von Verbindungen (I) in denen R^5 ein benzyli-scher Substituent ist, erhalten werden.

Die entstehenden substituierten Hydroxamsäuren (I), in denen R⁴ oder R⁵ oder R⁴ und R⁵ gleich Wasserstoff sind, können durch Alkylierung oder Acylierung nach an sich bekannten Methoden (wie z.B. in R.C. Larock, Comprehensive Organic Transformations, VCH Weinheim beschrieben) in die Zielverbindungen (I) übergeführt werden. Als typische Methode wird die Hydroxamsäure (I, R⁴ oder R⁵ oder R⁴ und R⁵ gleich Wasserstoff) mit Säurechloriden in Gegenwart einer Base umgesetzt. Geeignete Basen sind z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide, -carbonate oder -hydrogencarbonate oder organische Basen, wie z.B. Trialkylamine oder Pyridine. Eingesetzt werden können auch Festphasen-gebundene Basen, wie die oben erwähnten Beispiele. Die Reaktion wird vorteilhaft in einem inerten Lösungsmittel bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 50°C durchgeführt. Beispiele für inerte Lösungsmittel sind weiter oben aufgeführt.

15

Die Erfindung betrifft auch ein Verfahren zur Herstellung der oben definierten Verbindungen der Formel (I),



20 worin R¹, R², R³, R⁴, R⁵, X, Y und n die weiter oben angegebene Bedeutung haben und mindestens einer der Reste R⁴ oder R⁵ -C(W)R⁸, -C(W)OR⁸, -C(W)SR⁸, -C(W)NR⁸₂, -C(W)NR⁸-NR⁸₂, -C(W)NR⁸-NR⁸[C(W)R⁸], -SO₂NR⁸₂, -SO₂OR⁸, -S(O)R⁸, -S(O)₂R⁸, -PW₂R⁸ oder -PWR⁸ bedeutet, durch Umsetzung einer Verbindung der Formel (I), worin R⁴ und R⁵ Wasserstoff bedeuten, mit einer Verbindung der

25 Formel (IV),



worin Hal ein Halogenatom ist und R^{12} ein Rest ist, der ausgewählt wird aus der Gruppe bestehend aus $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8_2$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$ und $-PW(OR^8)_2$, worin W und R^8 die weiter oben definierte Bedeutung besitzen.

5

Zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), in denen n 1 bedeutet, kann am Pyridin-Stickstoff oxidiert werden (siehe z.B. Houben-Weyl, 4. Auflage (1992), Bd. E 7b, G. Thieme, Stuttgart). Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise organische Persäuren, wie 3-Chlorperbenzoesäure, und Wasserstoffperoxid.

10

Die Säure der Formel (II), worin X $-CH=$ ist und R^1 CF_3 bedeutet, ist als Substanz beschrieben und käuflich, von z.B. Aldrich (Steinheim, Deutschland), erhältlich.

Andere Pyridine wie auch die Pyrimidine können nach literaturbekannten Methoden hergestellt werden (siehe z.B. D. Spitzner „Methoden der Organischen Chemie“, Houben-Weyl, 4. Auflage (1992) Bd. E 7b, G. Thieme, Stuttgart; M.G. Hoffmann, A. Nowak, M. Müller, Houben-Weyl, 4. Auflage (1998), Bd. E 9b/Part 1).

15

Die erfindungsgemäßen Verfahren eignen sich vorzugsweise zur parallelisierten Reaktionsdurchführung.

20

Kollektionen aus Verbindungen der Formel (I), die nach oben genannten Schema synthetisiert werden, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte oder Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise verstanden, wie sie beispielsweise durch S.H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, Seite 69 bis 77 beschrieben ist.

25

30

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, wie sie beispielsweise von den Firmen Stem Corporation, Woodrolfe road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, England oder H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Deutschland oder der Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, England, angeboten werden. Für die parallelisierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise von der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

10

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständig integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA, bezogen werden.

15

20

Neben den hier beschriebenen kann die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vollständig oder partiell durch Festphasen-unterstützte Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepaßten Synthese an ein Syntheseharz gebunden. Festphasen-unterstützte Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998.

25

30

Die Verwendung von Festphasen-unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisiert ausgeführt werden können. Zum Beispiel kann die "Teebeutelmethode" (Houghten, US 4,631,211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135) mit Produkten der Firma IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA teilweise automatisiert werden. Die Automatisierung von Festphasen-

unterstützten Parallelsynthesen gelingt beispielsweise durch Apparaturen der Firmen Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA oder MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Deutschland.

- 5 Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert Verbindungen der Formel (I) in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei Verbindungen der Formel (I) enthalten.

10

Die Verbindungen der Formel (I) eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren, Helminthen und Mollusken, ganz besonders bevorzugt zur Bekämpfung von Insekten und Spinnentieren, die in der

- 15 Landwirtschaft, bei der Tierzucht, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

- 20 Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Eotetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Eutetranychus* spp..
- 25 Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus aselus*, *Armadium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

- 30 Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

5

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

10 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp..

15 Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* pp., *Damalinea* spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*,
20 *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp..

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*,
25 *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelus bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..

30 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,

- Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp.,
 Earias insulana, Heliothis spp., Laphygma exigua, Mamestra brassicae, Panolis
 flammea, Prodenia litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella,
 Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella,
 5 Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella,
 Homona magnanima, Tortrix viridana.

- Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizophorthera dominica,
 Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni,
 10 Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psyllodes
 chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis,
 Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus,
 Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma, Anthrenus
 spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus
 15 hololeucus, Gibbium psyllodes, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp.,
 Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra
 zealandica.

- Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp.,
 20 Monomorium pharaonis, Vespa spp..

- Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp.,
 Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala,
 Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hypobosca spp.,
 25 Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio
 hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata,
 Dacus oleae, Tipula paludosa.

- Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp..
 30

Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

Aus der Klasse der Helminthen z.B. *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*, *Cooperia*, *Chabertia*, *Strongyloides*, *Oesophagostomum*, *Hyostomylus*, *Ancylostoma*, *Ascaris* und *Heterakis* sowie *Fasciola*.

- 5 Aus der Klasse der Gastropoda z.B. *Deroceras* spp., *Arion* spp., *Lymnaea* spp., *Galba* spp., *Succinea* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Oncomelania* spp..
Aus der Klasse der Bivalva z.B. *Dreissena* spp..

Weiterhin lassen sich Protozoen, wie *Eimeria*, bekämpfen.

10

Zu den pflanzenparasitären Nematoden, die erfindungsgemäß bekämpft werden können, gehören beispielsweise die wurzelparasitären Bodennematoden wie z.B. solche der Gattungen *Meloidogyne* (Wurzelgallennematoden, wie *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne hapla* und *Meloidogyne javanica*), *Heterodera* und

- 15 *Globodera* (zystenbildende Nematoden, wie *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Heterodera trifolii*) sowie der Gattungen *Radopholus* wie *Radopholus similis*, *Pratylenchus* wie *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans* und *Pratylenchus curvatus*; *Tylenchulus* wie *Tylenchulus semipenetrans*, *Tylenchorhynchus*, wie *Tylenchorhynchus dubius* und *Tylenchorhynchus claytoni*,
20 *Rotylenchus* wie *Rotylenchus robustus*, *Heliocotylenchus* wie *Haliocotylenchus multicinctus*, *Belonoaimus* wie *Belonoaimus longicaudatus*, *Longidorus* wie *Longidorus elongatus*, *Trichodorus* wie *Trichodorus primitivus* und *Xiphinema* wie *Xiphinema index*.

- 25 Ferner lassen sich mit den erfindungsgemäßen Verbindungen die Nematodengattungen *Ditylenchus* (Stengelparasiten, wie *Ditylenchus dipsaci* und *Ditylenchus destructor*), *Aphelenchoides* (Blattnematoden, wie *Aphelenchoides ritzemabosi*) und *Anguina* (Blütenneematoden, wie *Anguina tritici*) bekämpfen.
- 30 Bevorzugt eignen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen zur Bekämpfung von saugenden Insekten, wie Aphiden (z. B. *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraecola*, *Aphis gossypii*, *Aphis nasturtii*, *Dysaphis plantaginea*, *Eriosoma* spp.,

Rhopalosiphum padi, Acyrthosiphon pisum, Pemphigus bursarius, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Myzus euphorbiae, Phylloxera spp., Toxoptera spp, Brevicoryne brassicae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Nasonovia ribisnigri, Sitobion avenae, Brachycaudus helychrysi oder Phorodon humuli), Zikaden
5 (Idioscopus clypealis, Scaphoides titanus, Empoasca onuki, Empoasca vitis, Empoasca devastans, Empoasca libyca, Empoasca biguttula, Empoasca facialis, oder Erythroneura spp), Thrips (Hercinothrips femoralis, Scirtothrips aurantii, Scirtothrips dorsalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Kakothrips spp., Thrips oryzae, Thrips palmi, Thrips
10 tabaci) oder Weiße Fliege (Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aleurodes proletella).

Die Erfindung betrifft auch Mittel, beispielsweise Pflanzenschutzmittel, vorzugsweise insektizide, akarizide, ixodizide, nematizide, molluskizide oder fungizide, besonders
15 bevorzugt insektizide und akarizide Mittel, die eine oder mehrere Verbindungen der Formel (I) neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel (I) im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%.

20

Zur Herstellung der erfindungsgemäßen Mittel gibt man den Wirkstoff und die weiteren Zusätze zusammen und bringt sie in eine geeignete Anwendungsform.

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formeln (I) im
25 allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%. Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben ist. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher beispielsweise in Frage:

30 Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EC), wäßrige Lösungen (SL), Emulsionen, versprühbare Lösungen, Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC), Suspoemulsionen (SE), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von Mikro-,

Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), ULV-Formulierungen, Mikro kapseln, Wachse oder Köder.

- Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und beispielsweise
- 5 beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.
- 10 Die notwendigen Formulierungshilfsmittel, d.h. Träger- und/oder oberflächenaktive Stoffe, wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.;
- 15 Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hanser Verlag
- 20 München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix. Spritzpulver sind

25 in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenol-sulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium enthalten.

30

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol

oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Ca-dodecylbenzol-sulfonat oder nichtionische Emulgatoren, wie

- 5 Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykoether, Fettalkoholpolyglykoether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxyethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.
- 10 Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit, Pyrophillit oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol,
- 15 polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen, wie Sand und Kaolinite, oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.
- 20 In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration üblicherweise etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

- 30 Daneben enthalten die genannten Wirkstoffformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granuliert Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden
5 vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,0005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie
10 jedoch zwischen 0,001 und 5 kg/ha Wirkstoff.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischungen mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder
15 Herbiziden vorliegen.

Gegenstand der Erfindung ist daher auch ein Mittel mit insektizider, akarizider, ixodiziner, nematizider und/oder molluskizider Wirkung, welches neben einer
20 Verbindung der Formel (I) mindestens einen weiteren Wirkstoff aus der Gruppe Insektizide, Akarizide, Nematizide, Fungizide, Herbizide und wachstumsregulierende Stoffe enthält.

Zu den Schädlingsbekämpfungsmitteln zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, Formamidine, Zinnverbindungen und durch
25 Mikroorganismen hergestellte Stoffe.

Bevorzugte Mischungspartner sind:

- 30 1. aus der Gruppe der Phosphorverbindungen
Acephate, Azamethiphos, Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, Bromophos, Bromophos-ethyl, Cadusafos (F-67825), Chlorethoxyphos, Chlorfenvinphos,

Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl, Demeton, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methyl sulfon, Dialifos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, Dimethoate, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrinfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfothion, Fenthion, Flupyrzofos, Fonofos, Formothion, 5 Fosthiazate, Heptenophos, Isazophos, Isothioate, Isoxathion, Malathion, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Salithion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Parathion, Parathion-methyl, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosfolan, Phosphocarb (BAS-301), Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Propaphos, 10 Proetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridapenthion, Quinalphos, Sulprofos, Temephos, Terbufos, Tebupirimfos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorphon, Vamidothion;

2. aus der Gruppe der Carbamate

15 Alanycarb (OK-135), Aldicarb, 2-sec.-Butylphenylmethylcarbamate (BPMC), Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Benfuracarb, Ethiofencarb, Furathiocarb, HCN-801, Isoprocarb, Methomyl, 5-Methyl-m-cumenylbutyryl(methyl)carbamate, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, 1-Methylthio(ethylideneamino)-N-methyl-N-(morpholinothio)carbamate 20 (UC 51717), Triazamate;

3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

Acrinathrin, Allethrin, Alphamethrin, 5-Benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R)-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, Beta-Cyfluthrin, 25 alpha-Cypermethrin, Beta-Cypermethrin, Bioallethrin, Bioallethrin((S)-cyclopentylisomer), Bioresmethrin, Bifenthrin, (RS)-1-Cyano-1-(6-phenoxy-2-pyridyl)methyl-(1RS)-trans-3-(4-tert.butylphenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (NCI 85193), Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cythithrin, Cypermethrin, Cyphenothrin, Deltamethrin, Empenthrin, Esfenvalerate, Fenfluthrin, 30 Fenpropathrin, Fenvalerate, Flubrocycythrinate, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate (D-Isomer), Imiprothrin (S-41311), Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Phenothrin ((R)-Isomer), Prallethrin, Pyrethrine (natürliche Produkte), Resmethrin, Tefluthrin,

Tetramethrin, Theta-Cypermethrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Zeta-Cypermethrin (F-56701);

4. aus der Gruppe der Amidine

5 Amitraz, Chlordimeform;

5. aus der Gruppe der Zinnverbindungen

Cyhexatin, Fenbutatinoxide;

10 6. Sonstige

Abamectin, ABG-9008, Acequinocyl, Azadirachtin, Acetamiprid, Anagrapha falcitera, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, AL-9811, ANS-118, Azadirachtin, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, Bensultap, Bifenazate (D-2341), Binapacryl, BJL-932, Bromopropylate, BAJ-2740 (Spirodiclofen), BSN 2060 (Spiromesifen), BTG-504, BTG-505, Buprofezin, Camphechlor, Cartap, Chlorobenzilate, Chlorfenapyr, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Chlorfentezine, Chloproxyfen, Chromafenozide (ANS-118), A-184699, Clothianidin, Cyclopropanecarbonsäure-(2-naphthylmethyl)ester (Ro12-0470), Cyromazin, CM-002X, DBI-3204, Diaclofen (Thiamethoxam), 20 Diafenthiuron, DBI-3204, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-propyloxy)phenyl)-carbamoyl-2-chlorbenzcarboximid-säureethylester, DDT, Dicofol, Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylylidene, Dihydroxymethyl-dihydroxypyrrolidin, Dinobuton, Dinocap, Diofenolan, DPX-062, Enamectin-Benzozate (MK-244), Endosulfan, Ethiprole (Sulfethiprole), Ethofenprox, 25 Etoxazole (YI-5301), Fenazaquin, Fenoxycarb, Fipronil, Flonicamid (IKI 220), Fluazuron, Flumite (Flufenzine, SZI-121), 2-Fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl)-4-methyl-1-pentyl)diphenylether (MTI 800), Granulose- und Kempolyederviren, Fenpyroximate, Fenthioncarb, Fluacrypyrim, Flufenzine, Flubenzimine, Flubrocylthrinat, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Flufenprox (ICI-A5683), Flufenzine, Fluproxyfen, FMC- 30 F6028, Gamma-HCH, Halofenozide (RH-0345), Halofenprox (MTI-732), Hexaflumuron (DE_473), Hexythiazox, HOI-9004, Hydramethylnon (AC 217300), Lufenuron, L-14165, Imidacloprid, Indoxacarb (DPX-MP062), Kanemite (AKD-

- 2023), M-020, MTI-446, Ivermectin, M-020, IKA-2000, MKI-245, Methoxyfenozide (Intrepid, RH-2485), Milbemectin, NC-196, Neemgard, Nitenpyram (TI-304), 2-Nitromethyl-4,5-dihydro-6H-thiazin (DS 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,2-thiazinan-3-ylcarbamaldehyde (WL 108477),
- 5 Novaluron, NC-196, NNI-0001, Nidintefuran, Propargite, Pyriproxyfen (S-71639), Pirydaryl, Protrifenbute, Pyriproxyfen, NC-196, NC-1111, NNI-9768, Novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, Propargite, Pymethrozone, Pyridaben, Pyrimidifen (SU-8801), R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, Silafluofen, Silomadine (CG-177), Spinosad, Spirodiclofen,
- 10 Spiromesifen, SU-9118, Tebufenozide, Tebufenpyrad (MK-239), Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thiadiazid, Thiocyclam, Thiamethoxam, TI-435, Tolfenpyrad (OMI-88), Triazamate (RH-7988), Trifluridon, Triethoxyspinosyn A, Verbutin, Vertalec (Mykotal), YI-5301 und Yi-6101.
- 15 Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in Ch.R. Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12. Auflage, British Crop Protection Council, Farnham 2000, beschrieben sind.
- Als Fungizide, die mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I)
- 20 kombiniert werden können, sind z.B. folgende Produkte zu nennen:
- Aldimorph, Andoprim, Anilazine, BAS 480F, BAS 450F, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Bitertanol, Bromuconazol, Buthiobate, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, CGA 173506, Cyproflumuron, Dichlofluanid, Dichlomezin,
- 25 Diclobutrazol, Diethofencarb, Difenconazol (CGA 169374), Difluconazole, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazole, Dinocap, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Edifenfos, Ethirimol, Etridiazot, Fenarimol, Fenfuram, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Ferimzone (TF164), Fluazinam, Fluobenzimine, Flouxastrobin, Fluquinconazole, Fluorimide, Flusilazole,
- 30 Flutolanil, Fluthafol, Folpet, Fosetylaluminium, Fuberidazole, Fulsulfamide (MT-F 651), Furalaxyl, Furconazol, Furmecycloz, Guazatine, Hexaconazole, ICI A5504, Imazalil, Imibenconazole, Iprobenfos, Iprodione, Isoprothiolane, KNF 317, Kupferver-

- bindungen wie Cu-oxychlorid, Oxine-Cu, Cu-oxide, Mancozeb, Maneb, Mepanipyrim (KIF 3535), Metconazol, Mepronil, Metalaxyl, Methasulfocarb, Methfuroxam, MON 24000, Myclobutanil, Nabam, Nitrothalidopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxycarboxin, Penconazol, Pencycuron, PP 969, Probenazole, Propineb, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propiconazol, Prothiocarb, Pyracarbolid, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyroquilon, Rabenzazole, RH7592, Schwefel, Tebuconazole, TF 167, Thiabendazole, Thicyofen, Thiofanatemethyl, Thiram, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Tricyclazole, Tridemorph, Triflumizol, Triforine, Validamycin, Vinchlozolin, XRD 563, Zineb, Natriumdodecyl-sulfonat, Natrium-dodecyl-sulfat, Natrium-C13/C15-alkoholethersulfonat, Natrium-cetostearyl-phosphatester, Dioctyl-natrium-sulfosuccinat, Natrium-isopropyl-naphthalene-sulfonat, Natrium-methylenebisnaphthalene-sulfonat, Cetyl-trimethyl-ammonium-chlorid, Salze von langkettigen primären, sekundären oder tertiären Aminen, Alkyl-propyleneamine, Lauryl-pyrimidiniumbromid, ethoxylierte quarternierte Fettamine, Alkyl-dimethyl-benzyl-ammoniumchlorid und 1-Hydroxyethyl-2-alkyl-imidazolin.

- Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,00001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

- Gegenstand der Erfindung ist daher auch ein Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen von Pflanzen, wobei man die Pflanzen und/oder die Schädlinge mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel (I) behandelt. Ebenfalls Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung einer Verbindung der Formel (I) zur Bekämpfung von Schädlingen von Pflanzen.

- Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Endo- und Ektoparasiten auf dem human- und veterinärmedizinischen Gebiet bzw. auf dem Gebiet der Tierhaltung. Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe

geschieht hier in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießen (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in
5 Form beispielsweise der Injektion.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können demgemäß auch besonders vorteilhaft zur Behandlung von Warmblütlern, insbesondere in der Viehhaltung (z.B. Rinder, Schafe, Schweine und Geflügel wie Hühner, Gänse usw.)
10 eingesetzt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung werden den Tieren die Verbindungen, gegebenenfalls in geeigneten Formulierungen und gegebenenfalls mit dem Trinkwasser oder Futter oral verabreicht. Da eine Ausscheidung im Kot in wirksamer Weise erfolgt, läßt sich auf diese Weise sehr einfach die Entwicklung von Insekten im Kot der Tiere verhindern. Die jeweils
15 geeigneten Dosierungen und Formulierungen sind insbesondere von der Art und dem Entwicklungsstadium der Nutztiere und auch vom Befallsdruck abhängig und lassen sich nach den üblichen Methoden leicht ermitteln und festlegen. Die Verbindungen können bei Rindern z.B. in Dosierungen von 0,01 bis 1 mg/kg Körpergewicht eingesetzt werden.

20 Neben den bisher genannten Applikationsverfahren zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eine hervorragende systemische Wirkung. Die Wirkstoffe können daher auch über Pflanzenteile, unterirdische wie oberirdische (z.B. Wurzel, Stolonen, Stengel, Stamm, Blatt), in die Pflanzen eingebracht werden, wenn die
25 Wirkstoffe in flüssiger oder fester Form auf, in und/oder in die direkte Umgebung der Pflanze appliziert werden (z.B. Granulate in der Erdapplikation, Applikation in gefluteten Reisfeldern, Stamminjektion bei Bäumen, Stengelbandagen bei perenierenden Pflanzen, Stem painting, z.B. bei Hopfen.

30 Daneben sind die erfindungsgemäßen Wirkstoffe, gegebenenfalls in Coformulierung mit Fungiziden, in besonderer Weise zur Behandlung von vegetativem und generativem pflanzlichen Vermehrungsmaterial einsetzbar, wie z.B. von Saatgut von

beispielsweise Getreide, Gemüse, Baumwolle, Reis, Zuckerrübe und anderen Kultur- und Zierpflanzen, von Zwiebeln, Stecklingen und Knollen weiterer vegetativ vermehrter Kultur- und Zierpflanzen. Die Behandlung hierfür kann vor der Saat bzw. dem Pflanzvorgang erfolgen (z.B. durch spezielle Techniken des 'Seed Coatings',
5 durch Beizung in flüssiger oder fester Form oder als 'Seedbox Treatment'), während des Saatvorgangs bzw. des Pflanzens oder nach dem Saat- bzw. Pflanzvorgang durch spezielle Applikationstechniken (z.B. Saatreihenbehandlung). Die angewandte Wirkstoffmenge kann entsprechend der Anwendung in einem größerem Bereich schwanken. Im allgemeinen liegen die Aufwandsmengen zwischen 1 g und 10 kg
10 Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche. Die Behandlungsverfahren für pflanzliches Vermehrungsmaterial und das so behandelte pflanzliche Vermehrungsmaterial sind weitere Gegenstände der Erfindung.

Die Verbindungen der Formel (I) können auch zur Bekämpfung von Schädnpflanzen
15 in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pflanzenschutzmitteln, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten, wie bestimmten
20 Insekten oder Mikroorganismen, wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z.B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

25 Bevorzugt ist die Anwendung in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z.B. von Getreide, wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais, oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

Bei der Anwendung in transgenen Kulturen, insbesondere mit Insektenresistenzen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadorganismen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell
5 erweitertes Schädlingsspektrum, das bekämpft werden kann oder veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) zur Bekämpfung von Schadorganismen in transgenen Kulturpflanzen,
10 sowie ein Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen von transgenen Pflanzen, bei dem man die transgene Pflanze und/oder die Schädlinge mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel (I) behandelt.

Neben lethaler Wirkung auf Schädlingen zeichnen sich die Verbindungen der
15 Formel (I) auch durch einen ausgeprägten Repellenteffekt aus.

Repellent im Sinne der Verbindung ist ein Stoff oder Stoffgemisch, das abwehrend oder vertreibend auf andere Lebewesen, insbesondere Schädlinge und Lästlinge wirkt. Der Begriff umfaßt dabei auch Effekte wie den Antifeeding-Effekt, wobei die
20 Nahrungsaufnahme gestört oder verhindert wird (fraßabweisender Effekt), Unterdrückung der Eiablage oder eine Beeinflussung der Populationsentwicklung.

Gegenstand der Erfindung ist daher auch die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) zur Erzielung der genannten Effekte, insbesondere bei den in den
25 biologischen Beispielen benannten Schädlingen.

Gegenstand der Erfindung ist auch ein Verfahren zur Abwehr oder Vertreibung von Schadorganismen, wobei man eine oder mehrere Verbindungen der Formel (I) an dem Ort ausbringt, von dem die Schadorganismen ferngehalten oder vertrieben
30 werden sollen.

Ausbringen kann im Falle einer Pflanze beispielsweise eine Behandlung der Pflanze aber auch des Saatguts bedeuten.

Es ist, was die Beeinflussung von Populationen angeht von Interesse, daß die
5 Effekte auch hintereinander bei der Entwicklung einer Population beobachtet
werden, wobei sie sich aufaddieren können. Hierbei kann der Einzeleffekt selbst nur
einen Wirkungsgrad deutlich unter 100 %ige haben und insgesamt am Ende doch
eine 100 % Wirkung erreicht werden.

10 Außerdem zeichnen sich die Verbindungen der Formel (I) dadurch aus, daß man –
will man die oben angeführten Effekte ausnutzen – zu einem früheren Zeitpunkt als
bei einer direkten Bekämpfung üblich das Mittel appliziert. Der Effekt hält häufig
lange Zeit an, so daß eine Wirkungsdauer von mehr als 2 Monaten erreicht wird.

15 Die Effekte treten bei Insekten, Spinnentieren und den anderen der oben erwähnten
Schädlinge auf.

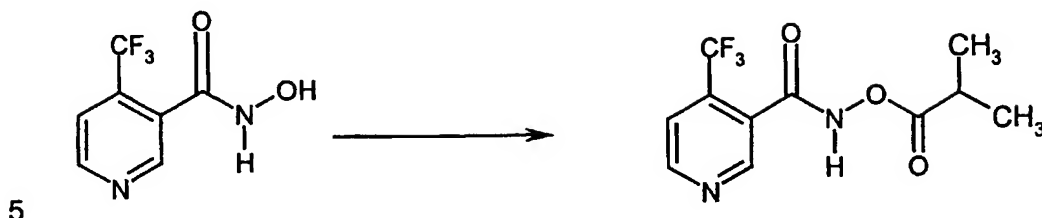
Die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen beinhaltet neben direkter
Applikation auf die Schädlinge jede andere Applikation, bei der Verbindungen der
20 Formel (I) auf die Schädlinge wirken. Solche indirekten Applikationen können
beispielsweise in der Anwendung von Verbindungen liegen, die, beispielsweise im
Boden, der Pflanze oder dem Schädling, zu Verbindungen der Formel (I) zerfallen
oder abgebaut werden.

25 Auf den Inhalt der deutschen Patentanmeldung 102 39 905.0, deren Priorität die
vorliegende Anmeldung beansprucht, sowie der beiliegenden Zusammenfassung
wird ausdrücklich Bezug genommen; er gilt durch Zitat als Bestandteil dieser
Beschreibung.

30 Die nachfolgenden Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung.

Chemische Beispiele

Beispiel 1:

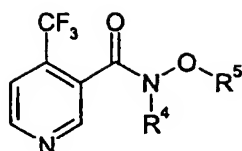


0,25 g (0,0012 mol) 4-Trifluormethyl-nikotinhydroxamsäure wurden in 10 ml
 Dichlormethan gelöst. 0,17 ml (0,0012 mol) Triethylamin wurden dazugegeben und
 10 die Reaktionsmischung 5 Minuten bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurden 0,13
 ml (0,0012 mol) iso-Butyrochlorid gelöst in 3 ml Dichlormethan tropfenweise
 dazugegeben und die Lösung dann 2 Stunden lang bei Raumtemperatur gerührt.
 Die Reaktion wurde durch Zugabe von Wasser und Extraktion mit Dichlormethan
 aufgearbeitet. Nach Trocknen über MgSO_4 wurde filtriert und das Lösungsmittel
 15 entfernt. Man erhielt 0,35 g eines hellen Öls. Dieses wurde über Chromatographie
 mit Heptan und Essigester gereinigt. Ausbeute: 0,2 g (58%) helles Öl.

$^1\text{H NMR}$ 300MHz (CDCl_3): 9,38 (br s 1H NH), 8,90 (m, 2H, 2-H Pyridin), 7,66 (d,
 J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin), 2,84 (m, 1H, CH), 1,32 (m, 6H, CH_3)
 20

In analoger Weise wurden die in den nachfolgenden Tabellen aufgeführten
 Verbindungen hergestellt.

Tabelle 1



5

Beispiel Nr.	R ⁴	R ⁵	Bemerkung
1	H	-CO-CH(CH ₃) ₂	Öl
2	-CO-(4-trifluormethylpyrid-3-yl)	-CH ₃	Öl
3	-CO-(4-trifluormethylpyrid-3-yl)	-C ₂ H ₅	Öl
4	H	-CO-CH ₂ -O-C ₆ H ₅	Öl ¹⁾
5	-CO-(2-methoxyphenyl)	-CO-(2-methoxyphenyl)	Öl ²⁾
6	H	-CO-(2-chlor-4-fluorphenyl)	Öl ³⁾
7	-CO-(2-chlorphenyl)	-CO-(2-chlorphenyl)	Öl
8	H	-CO-(2-chlorphenyl)	Öl ⁴⁾
9	H	-CO-tert. Butyl	Öl
10	-CO-cyclopropyl	-CO-cyclopropyl	Öl
11	-CO-CH=CH-CH ₃	-CO-CH=CH-CH ₃	Öl
12	H	-CO-(4-methylphenyl)	Öl ⁵⁾
13	-CO-phenyl	-CO-phenyl	Öl ⁶⁾
14	-CO-CH ₃	-CO-CH ₃	Öl ⁷⁾
15	H	-CO-CH ₃	Öl

10 ¹⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,72 (br s 1H NH); 8,99 (m, 1H, 2-H Pyridin); 8,61 (s, 1H, 6-H Pyridin); 7,54 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 7,36 (tr, J=8Hz, 2H, 3', 5'-H Phenyl); 7,08 (tr, J=8Hz, 1H, 4'-H Phenyl); 6,99 (tr, J=8Hz, 2H, 2', 6'-H Phenyl); 4,68 (s, 2H, CH₂)

15 ²⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,06 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,84 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 7,65 (dd, J=6/2Hz, Phenyl); 7,32-7,52 (m, 3H, Phenyl); 6,80-6,96 (m, 3H, Phenyl); 6,82 (d, J=8Hz, 1H, Phenyl); 3,84 (s, 3H, CH₃); 3,79 (s, 2H, CH₂)

20 ³⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 8,99 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,83 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,12 (m, 1H, 6'-H Phenyl); 7,61 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,24 (m, 1H, 3'-H Phenyl); 7,08 (m, 1H, 5'-H Phenyl)

⁴⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 8,94 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,88 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,08 (m, 1H, 6'-H Phenyl); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,51 (m, 2H, 4', 5'-H Phenyl); 7,39 (m, 4H, 2', 6'-H Phenyl)

5 ⁵⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,92 (br s, 1H, NH); 8,96 (s, 1H, 2-H Pyridin); 8,90 (d, J=6Hz, 1H, 6-H Pyridin); 8,02 (m, 2H, Phenyl); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5H Pyridin); 7,30 (m, 2H, Phenyl); 2,44 (s, 3H, CH₃)

10 ⁶⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 9,38 (br s, 1H, NH); 8,90 (m, 2H, 6-H, 2-H Pyridin); 7,66 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 2,84 (m, 1H, CH); 1,32 (s, 6H, CH₃)

⁷⁾ ¹H NMR 300MHz (CDCl₃): 8,98 (d, J=6Hz; 1H, 6-H Pyridin); 8,63 (s, 1H, 2-H Pyridin); 7,61 (d, J=6Hz, 1H, 5-H Pyridin); 2,40 (s, 3H, CH₃); 2,20 (s, 3H, CH₃)

15 B. Formulierungsbeispiele

a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.

20 b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoymethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.

25 c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobernsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.

d) Ein emulgierbares Konzentrat lässt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexan als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 EO) als Emulgator.

- 5 e) Ein Granulat lässt sich herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30 % und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig. Dabei beträgt der Gewichtsanteil
10 des Spritzpulvers ca. 5 % und der des inerten Trägermaterials ca. 95 % des fertigen Granulats.

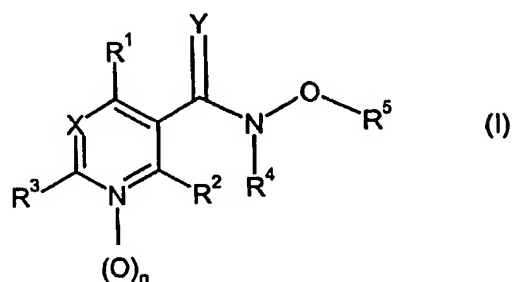
C. Biologische Beispiele

- 15 In den folgenden Beispielen werden Verbindungen als aktiv angesehen, wenn sie bei einer Konzentration von 500 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) oder weniger eine Wirkung auf die Schadorganismen von 50% oder mehr aufweisen.

- Angekeimte Ackerbohnen-Samen (*Vicia faba*) mit Keimwurzeln wurden in mit
20 Leitungswasser gefüllte Braunglasfläschchen übertragen und anschließend mit ca. 100 schwarzen Bohnenblattläusen (*Aphis fabae*) belegt. Pflanzen und Blattläuse wurden dann für 5 Sekunden in eine wässrige Lösung der zu prüfenden und formulierten Verbindung getaucht. Nach dem Abtropfen wurden Pflanze und Tiere in einer Klimakammer gelagert (16 Stunden Licht/Tag, 25°C, 40-60% RF). Nach 3 und
25 6 Tagen Lagerung wurde die Mortalität der Verbindung auf die Blattläuse festgestellt. Die Verbindungen gemäß der folgenden Beispiele waren aktiv: 1, 2, 5 bis 11, 13 bis 15.

Patentansprüche

1. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze,



5

wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

X ist =CH- oder =N-;

Y ist =O oder =S;

10 n ist 0 oder 1;

R¹ ist (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl, -S(Halogen)₅ oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

15 R², R³ sind unabhängig voneinander Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₁-C₆)-Haloalkyl oder Halogen, wobei eine oder zwei CH₂-Gruppen durch -O- oder -S- oder -N(C₁-C₆)-Alkyl ersetzt sein können, mit der Maßgabe, daß Heteroatome nicht benachbart sein dürfen;

20 R⁴ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl oder R⁵, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;

25 R⁵ ist Wasserstoff, (C₁-C₁₀)-Alkyl, (C₃-C₁₀)-Alkenyl, (C₃-C₁₀)-Alkynyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-Cycloalkinyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl oder R⁷, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können;

R^6, R^7 sind unabhängig voneinander $-C(W)R^8, -C(W)OR^8, -C(W)SR^8, -C(W)NR^8_2,$
 $-C(W)NR^8-NR^8_2, -C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8], -SO_2NR^8_2, -SO_2OR^8, -S(O)R^8, -$
 $S(O)_2R^8, -PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$;

W ist =O, =S, =NOR⁸ oder =NNR⁸₂;

- 5 R^8 ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C₁-C₆)-Alkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl,
 (C₂-C₆)-Alkinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-
 (C₁-C₄)-Alkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₂-C₄)-
 Alkenyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₂-C₄)-Alkenyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-
 Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₂-C₆)-Alkinyl-(C₃-C₈)-
 10 Cycloalkyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-
 Cycloalkenyl, (C₆-C₁₄)-Aryl, (C₃-C₁₀)-Heterocyclyl, wobei die genannten Reste
 gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können und
 gegebenenfalls zwei Reste R^8 zusammen ein Ringsystem bilden;

- mit der Maßgabe, daß mindestens einer der Reste R^4 oder R^5 eine der für R^6 oder
 15 R^7 definierten Bedeutungen besitzt, und daß, falls $R^5 -C(=O)R^a$ ist, wobei R^a
 (C₁-C₆)-Alkyl oder (C₆-C₁₄)-Aryl bedeutet und wobei die genannten Reste
 gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können, R^4 Wasserstoff
 oder gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiertes (C₃-C₁₀)-Alkenyl,
 (C₃-C₁₀)-Alkinyl, (C₃-C₁₀)-Cycloalkyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl, (C₈-C₁₀)-
 20 Cycloalkinyl oder R^6 bedeutet.

2. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin X =CH-
 ist.
- 25 3. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin Y =O
 ist.
4. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin n = 0
 ist.
- 30 5. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R^1 CF₃
 ist.

6. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R^2 und R^3 Wasserstoff sind.
- 5 7. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R^4 Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, ein- oder mehrfach durch F und/oder Cl substituiertes (C_1-C_6) -Alkyl oder R^6 bedeutet.
8. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R^5 (C_1-C_6) -Alkyl, (C_3-C_6) -Alkenyl, (C_3-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl oder (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen oder ganz besonders bevorzugt R^7 bedeutet, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
- 10 9. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, worin R^6 und R^7 unabhängig voneinander $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$ bedeuten, W = O ist und R^8 gleich oder verschieden (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen ist, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.
10. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:
- 25 X ist =CH-,
Y ist =O;
n ist 0,
 R^1 ist $-CF_3$,
 R^2 und R^3 sind Wasserstoff,
- 30 R^4 ist Wasserstoff, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$ oder $-S(O)_2R^8$;
 R^5 ist (C_1-C_6) -Alkyl, (C_3-C_6) -Alkenyl, (C_3-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff-

und/oder Schwefelringatomen, $-C(W)R^8$, $-S(O)R^8$ oder $-S(O)_2R^8$; wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.

11. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 10, worin die

5 Symbole und Indizes folgende Bedeutung haben:

R^4 ist $-C(W)R^8$ und insbesondere Wasserstoff;

R^5 ist $-C(W)R^8$, und

R^8 ist gleich oder verschieden Wasserstoff, (C_1-C_6) -Alkyl, (C_2-C_6) -Alkenyl, (C_2-C_6) -Alkynyl, (C_3-C_8) -Cycloalkyl, (C_6-C_{14}) -Aryl, (C_3-C_{10}) -Heterocyclyl mit
 10 insgesamt ein bis drei Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelringatomen, wobei die genannten Reste gegebenenfalls ein- oder mehrfach substituiert sein können.

12. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, wobei die

15 Substituenten an den Resten R^4 , R^5 und R^8 Gruppen R^9 mit der folgenden Bedeutung sind:

R^9 ist gleich oder verschieden R^{10} oder zwei Reste R^9 bilden zusammen mit den Atomen, an die sie gebunden sind, ein drei- bis achtegliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, gegebenenfalls mit einem oder mehreren Resten R^{10}
 20 substituiertes Ringsystem, das gegebenenfalls Heteroatome, vorzugsweise O, N, S, SO und/oder SO_2 , enthält;

R^{10} ist gleich oder verschieden R^8 , R^{11} , $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$,
 $-C(W)NR^8_2$, $-OC(W)R^8$, $-OC(W)OR^8$, $-OC(W)SR^8$, $-OC(W)NR^8_2$, $-SC(W)R^8$,
 $-SC(W)OR^8$, $-SC(W)SR^8$, $-SC(W)NR^8_2$, $-NR^8C(W)R^8$, $-N[C(W)R^8]_2$,
 25 $-NR^8C(W)OR^8$, $-NR^8C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$,
 $-NR^8-C(W)NR^8_2$, $-NR^8-NR^8C(W)R^8$, $-NR^8-N[C(W)R^8]_2$, $-N[(CW)R^8]-NR^8_2$,
 $-NR^8[(CW)NR^8_2]$, $-NR^8(C=NR^8)R^8$, $-NR^8(C=NR^8)NR^8_2$, $-O-NR^8_2$, $-O-$
 $NR^8(CW)R^8$, $-SO_2NR^8_2$, $-NR^8SO_2R^8$, $-SO_2OR^8$, $-OSO_2R^8$, $-OR^8$, $-NR^8_2$, $-SR^8$,
 $-SiR^8_3$, $-PR^8_2$, $-P(W)R^8_2$, $-SOR^8$, $-SO_2R^8$, $-PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$;
 30 oder zwei Reste R^{10} sind zusammen (W) , $(=N-R^8)$, $(=CR^8_2)$, $(=CHR^8)$, oder $(=CH_2)$;

W und R^8 besitzen die Definitionen gemäß Anspruch 1,

- R¹¹ ist gleich oder verschieden Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Thio, Amino, Formyl, (C₁-C₆)-Alkanoyl, (C₁-C₆)-Alkoxy, (C₃-C₆)-Alkenyloxy, (C₃-C₆)-Alkinyloxy, (C₁-C₆)-Haloalkyloxy, (C₃-C₆)-Haloalkenyloxy, (C₃-C₆)-Haloalkinyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₄-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Halocycloalkoxy, (C₄-C₈)-Halocycloalkenyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkoxy, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkoxy, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₂-C₄)-Alkenyloxy, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₂-C₄)-Alkenyloxy, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₂-C₆)-Alkinyl-(C₃-C₈)-Cycloalkoxy, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenyloxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₁-C₆)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Alkoxy-(C₃-C₆)-Alkenyloxy, Carbamoyl, (C₁-C₆)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl, (C₁-C₆)-Mono- oder Dihaloalkylcarbamoyl, (C₃-C₈)-Mono- oder Dicycloalkylcarbamoyl, (C₁-C₆)-Alkoxycarbonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Alkanoyloxy, (C₃-C₈)-Cycloalkanoyloxy, (C₁-C₆)-Haloalkoxycarbonyl, (C₁-C₆)-Haloalkanoyloxy, (C₁-C₆)-Alkanamido, (C₁-C₆)-Haloalkanamido, (C₂-C₆)-Alkenamido, (C₃-C₈)-Cycloalkanamido, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkanamido, (C₁-C₆)-Alkylthio, (C₃-C₆)-Alkenylthio, (C₃-C₆)-Alkinylthio, (C₁-C₆)-Haloalkylthio, (C₃-C₆)-Haloalkenylthio, (C₃-C₆)-Haloalkinylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₄-C₈)-Cycloalkenylthio, (C₃-C₈)-Halocycloalkthio, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylthio, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylthio, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylthio, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylthio, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₂-C₆)-Alkinyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylthio, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylthio, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylthio, (C₁-C₆)-Alkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Alkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-Alkinylsulfinyl, (C₁-C₆)-Haloalkylsulfinyl, (C₃-C₆)-Haloalkenylsulfinyl, (C₃-C₆)-Haloalkinylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-Halocycloalkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfinyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfinyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkinyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfinyl, (C₁-C₆)-Alkyl-

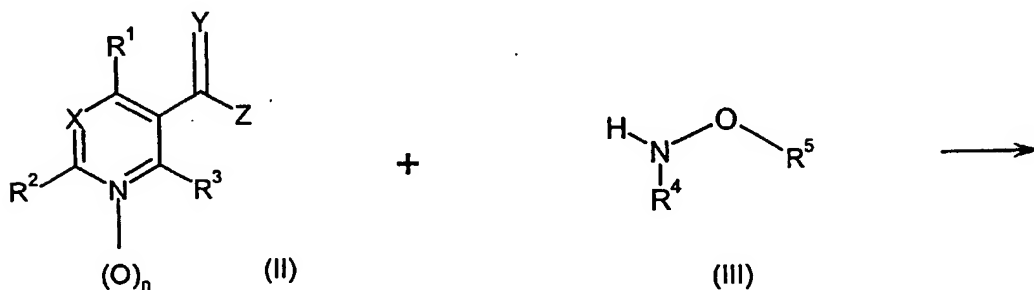
(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfinyl,
 (C₁-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Alkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-Alkylsulfonyl, (C₁-C₆)-
 Haloalkylsulfonyl, (C₃-C₆)-Haloalkenylsulfonyl, (C₃-C₆)-Haloalkylsulfonyl,
 (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-
 5 Halocycloalkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Halocycloalkenylsulfonyl, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-
 (C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylsulfonyl, (C₃-C₈)-
 Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylsulfonyl, (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-
 Alkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-
 (C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylsulfonyl, (C₁-C₆)-
 10 Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylsulfonyl, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₄-C₈)-
 Cycloalkenylsulfonyl, (C₁-C₆)-Dialkylamino, (C₁-C₆)-Alkylamino, (C₃-C₆)-
 Alkenylamino, (C₃-C₆)-Alkylamino, (C₂-C₆)-Haloalkylamino, (C₃-C₆)-
 Haloalkenylamino, (C₃-C₆)-Haloalkylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkylamino,
 (C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₃-C₈)-Halocycloalkylamino, (C₄-C₈)-
 15 Halocycloalkenylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₁-C₄)-Alkylamino, (C₄-C₈)-
 Cycloalkenyl-(C₁-C₄)-Alkylamino, (C₃-C₈)-Cycloalkyl-(C₃-C₄)-Alkenylamino,
 (C₄-C₈)-Cycloalkenyl-(C₃-C₄)-Alkenylamino, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₃-C₈)-
 Cycloalkylamino, (C₂-C₆)-Alkenyl-(C₃-C₈)-Cycloalkylamino, (C₂-C₆)-Alkyl-(C₃-
 C₈)-Cycloalkylamino, (C₁-C₆)-Alkyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₂-C₆)-
 20 Alkenyl-(C₄-C₈)-Cycloalkenylamino, (C₁-C₆)-Trialkylsilyl, Aryl, Aryloxy, Arylthio,
 Arylamino, Aryl-(C₁-C₄)-Alkoxy, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenyloxy, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylthio,
 Aryl-(C₂-C₄)-Alkenylthio, Aryl-(C₁-C₄)-Alkylamino, Aryl-(C₃-C₄)-Alkenylamino,
 Aryl-(C₁-C₆)-Dialkylsilyl, Diaryl-(C₁-C₆)-Alkylsilyl, Triarylsilyl und 5- oder 6-
 gliedriges Heterocyclyl, wobei der cyclische Teil der vierzehn letztgenannten
 25 Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe
 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C₁-C₄)-Alkyl, (C₁-C₄)-Haloalkyl,
 (C₃-C₈)-Cycloalkyl, (C₁-C₄)-Alkoxy, (C₁-C₄)-Haloalkoxy, (C₁-C₄)-Alkylthio,
 (C₁-C₄)-Haloalkylthio, (C₁-C₄)-Alkylamino, (C₁-C₄)-Haloalkylamino, Formyl und
 (C₁-C₄)-Alkanoyl substituiert ist.

30

13. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1
 umfassend die Umsetzung von aktivierten Carbonsäurederivaten der allgemeinen

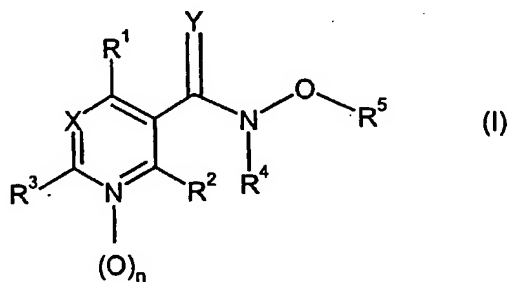
46

Formel (II) ist mit Hydroxylaminderivaten der Formel (III), worin R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X , Y und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben



5

14. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) nach Anspruch 1



worin R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X , Y und n die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben und mindestens einer der Reste R^4 oder R^5 $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8_2$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$ oder $-PW(OR^8)_2$ bedeutet, umfassend die Umsetzung einer Verbindung der Formel (I), worin R^4 und R^5 Wasserstoff bedeuten, mit einer Verbindung der Formel (IV),

15

$R^{12}\text{-Hal} \quad (IV)$

worin Hal ein Halogenatom ist und R^{12} ein Rest ist, der ausgewählt wird aus der Gruppe bestehend aus $-C(W)R^8$, $-C(W)OR^8$, $-C(W)SR^8$, $-C(W)NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8_2$, $-C(W)NR^8-NR^8[C(W)R^8]$, $-SO_2NR^8_2$, $-SO_2OR^8$, $-S(O)R^8$, $-S(O)_2R^8$, $-PWR^8_2$ und $-PW(OR^8)_2$, worin W und R^8 die in Anspruch 1 definierte Bedeutung besitzen.

15. Mittel mit insektizider, akarizider, ixodizider, nematizider und/oder molluskizider Wirkung gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder eines ihrer Salze nach Anspruch 1.
16. Mittel nach Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, daß es einen weiteren Wirkstoff aus der Gruppe Akarizide, Fungizide, Herbizide, Insektizide, Nematizide oder wachstumsregulierende Stoffe enthält.
17. Verfahren zur Bekämpfung, Abwehr oder Vertreibung von Schädlingen und/oder Lästlingen von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pflanzen und/oder Schädlinge/Lästlinge mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel (I) oder eines ihrer Salze nach Anspruch 1 behandelt.
18. Verfahren nach Anspruch 17, wobei es sich bei der Pflanze um eine transgene Kulturpflanze handelt.
19. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch 1 zur Bekämpfung, Abwehr oder Vertreibung von Schädlingen und/oder Lästlingen von Pflanzen.
20. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder ihrer Salze nach Anspruch 1 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Bekämpfung von von Endo- und Ektoparasiten.

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. März 2004 (11.03.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/020416 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 239/28,
213/82, 213/89, A01N 43/40, 43/54

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/009028

(22) Internationales Anmeldedatum:
14. August 2003 (14.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 39 905.0 30. August 2002 (30.08.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): BAYER CROPSCIENCE GMBH [DE/DE]; Brün-
ingstrasse 50, 65926 Frankfurt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BECKMANN, Marion
[DE/DE]; Dreiweidenstrasse 8, 65195 Wiesbaden (DE).
DÖLLER, Uwe [DE/DE]; Rembrandtring 24a, 63110
Rodgau (DE). KRAUTSTRUNK, Gerhard [DE/DE];
Franz-Lehar-Weg 48, 61118 Bad Vilbel (DE). SCHAPER,
Wolfgang [DE/DE]; Kapellenweg 5c, 86420 Diedorf (DE).
JANS, Daniela [DE/DE]; Schöne Aussicht 11, 61348 Bad
Homburg v. d. H. (DE). HEMPEL, Waltraud [DE/DE];
Zum Morgengraben 18, 65835 Liederbach (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AU,
AZ, BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ,
EC, GD, GE, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NI, NO,
NZ, OM, PG, PH, PL, RU, SC, SG, SY, TJ, TM, TN, TT,
UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

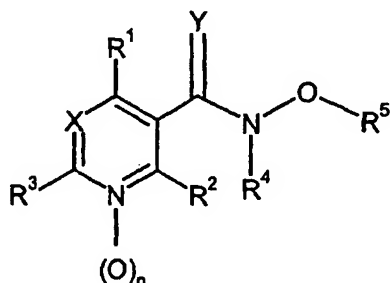
- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
eintreffen

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts: 22. April 2004

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED PYRIDINES OR PYRIMIDINES, METHOD FOR THEIR PRODUCTION, AGENTS CONTAINING
SAID SUBSTANCES AND THE USE THEREOF AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE PYRIDINE ODER PYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE ENT-
HALTENDE MITTEL UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula
(I), whereby the symbols and indices are defined as cited in the
description. Said compounds are suitable for controlling pests.

(57) Zusammenfassung: Beschrieben werden Verbindungen
der Formel (I) wobei die Symbole und Indizes die in der Be-
schreibung angegeben Bedeutungen haben. Diese eignen sich
zur Bekämpfung von Schädlingen.

WO 2004/020416 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 03/09028

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/28 C07D213/82 C07D213/89 A01N43/40 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 01 09104 A (SYNGENTA) 8 February 2001 (2001-02-08) cited in the application claims; table 1	1-7, 13, 15-20
A	DEBRA J. WALLACE: "OBSERVATIONS ON THE DDQ OXIDATION OF 1-ACYLDIHYDROPYRIDINES--" SYNTHESIS., vol. 12, 25 September 2001 (2001-09-25), pages 1784-9, XP002271357 GEORG THIEME VERLAG. STUTTGART., DE ISSN: 0039-7881 page 1784 -page 1785; table 2 -/-	1

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

24 February 2004

Date of mailing of the international search report

09/03/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 03/09028

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 136, no. 2, 2002 Columbus, Ohio, US; abstract no. 20083j, page 647; column 2; XP002271358 abstract -& JP 2001 335567 A (UBE) 4 December 2001 (2001-12-04)</p>	<p>1-4, 15-20</p>

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/09028

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0109104	A	08-02-2001	AU 6439500 A	19-02-2001
			BR 0012878 A	09-04-2002
			CN 1365357 T	21-08-2002
			WO 0109104 A1	08-02-2001
			EP 1200413 A1	02-05-2002
			JP 2003506360 T	18-02-2003
			US 6566518 B1	20-05-2003
JP 2001335567	A	04-12-2001	NONE	

INTERNATIONALE RESEARCHENBERICHT

Internatio Aktenzeichen

PCT/EP 03/09028

A. KLASSTIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D239/28 C07D213/82 C07D213/89 A01N43/40 A01N43/54

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Recherchiertes Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 01 09104 A (SYNGENTA) 8. Februar 2001 (2001-02-08) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Tabelle 1	1-7, 13, 15-20
A	DEBRA J. WALLACE: "OBSERVATIONS ON THE DDQ OXIDATION OF 1-ACYLDIHYDROPYRIDINES-" SYNTHESIS., Bd. 12, 25. September 2001 (2001-09-25), Seiten 1784-9, XP002271357 GEORG THIEME VERLAG. STUTTGART., DE ISSN: 0039-7881 Seite 1784 -Seite 1785; Tabelle 2	1

-/-

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen.

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"I" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benützung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

24. Februar 2004

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

09/03/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationaler Aktenzeichen

PCT/EP 03/09028

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	<p>CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 136, no. 2, 2002 Columbus, Ohio, US; abstract no. 20083j, Seite 647; Spalte 2; XP002271358 Zusammenfassung -& JP 2001 335567 A (UBE) 4. Dezember 2001 (2001-12-04)</p>	<p>1-4, 15-20</p>

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationaler Aktenzeichen

PCT/EP 03/09028

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0109104 A	08-02-2001	AU 6439500 A	19-02-2001
		BR 0012878 A	09-04-2002
		CN 1365357 T	21-08-2002
		WO 0109104 A1	08-02-2001
		EP 1200413 A1	02-05-2002
		JP 2003506360 T	18-02-2003
		US 6566518 B1	20-05-2003
JP 2001335567 A	04-12-2001	KEINE	